

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Commissioner
US Department of Commerce
United States Patent and Trademark
Office, PCT
2011 South Clark Place Room
CP2/5C24
Arlington, VA 22202
ETATS-UNIS D'AMERIQUE
in its capacity as elected Office

Date of mailing:

15 March 2001 (15.03.01)

International application No.:

PCT/JP00/06165

Applicant's or agent's file reference:

KM-094-X

International filing date:

08 September 2000 (08.09.00)

Priority date:

09 September 1999 (09.09.99)

Applicant:

YASUDA, Atsushi et al

1. The designated Office is hereby notified of its election made:



in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:

18 January 2001 (18.01.01)



in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer:

J. Zahra

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

THIS PAGE BLANK (USPTO)

PATENT COOPERATION TREATY

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

SEMYO, Kenji
Torimoto Kogyo Bldg.
38, Kanda-Higashimatsushitacho
Chiyoda-ku, Tokyo 101-0042
JAPON

| | |
|--|--|
| Date of mailing (day/month/year) 07 December 2000 (07.12.00) | IMPORTANT NOTIFICATION |
| Applicant's or agent's file reference KM-094-X | |
| International application No. PCT/JP00/06165 | |
| International publication date (day/month/year) Not yet published | |
| International filing date (day/month/year) 08 September 2000 (08.09.00) | Priority date (day/month/year) 09 September 1999 (09.09.99) |
| Applicant KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al | |

- The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
- An asterisk(*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

| <u>Priority date</u> | <u>Priority application No.</u> | <u>Country or regional Office or PCT receiving Office</u> | <u>Date of receipt of priority document</u> |
|-------------------------|---------------------------------|---|---|
| 09 Sept 1999 (09.09.99) | 11/255029 | JP | 28 Nove 2000 (28.11.00) |

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

Authorized officer

Tessadel PAMPLIEGA

Tdp

Telephone No. (41-22) 338.83.38

THIS PAGE BLANK (USPTO)

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

SENMYO, Kenji
Torimoto Kogyo Bldg.
38, Kanda-Higashimatsushitacho
Chiyoda-ku, Tokyo 101-0042
JAPON

Date of mailing (day/month/year)

15 March 2001 (15.03.01)

Applicant's or agent's file reference

KM-094-X

IMPORTANT NOTICE

International application No.

PCT/JP00/06165

International filing date (day/month/year)

08 September 2000 (08.09.00)

Priority date (day/month/year)

09 September 1999 (09.09.99)

Applicant

KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. et al

1. Notice is hereby given that the International Bureau has communicated, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this Notice:

AU, KR, US

In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present Notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:

AE, AG, AL, AM, AP, AT, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EA, EE, EP, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OA, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU,
The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

3. Enclosed with this Notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on 15 March 2001 (15.03.01) under No. WO 01/17975

REMINDER REGARDING CHAPTER II (Article 31(2)(a) and Rule 54.2)

If the applicant wishes to postpone entry into the national phase until 30 months (or later in some Offices) from the priority date, a demand for international preliminary examination must be filed with the competent International Preliminary Examining Authority before the expiration of 19 months from the priority date.

It is the applicant's sole responsibility to monitor the 19-month time limit.

Note that only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination.

REMINDER REGARDING ENTRY INTO THE NATIONAL PHASE (Article 22 or 39(1))

If the applicant wishes to proceed with the international application in the national phase, he must, within 20 months or 30 months, or later in some Offices, perform the acts referred to therein before each designated or elected Office.

For further important information on the time limits and acts to be performed for entering the national phase, see the Annex to Form PCT/IB/301 (Notification of Receipt of Record Copy) and Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

Authorized officer:

J. Zahra

Telephone No. (41-22) 338.83.38

THIS PAGE BLANK (USPTO)



P.B.5618 - Patentaan
2280 HV Rijswijk (ZH)
☎ +31 70 340 2040
TX 31651 epo nl
FAX +31 70 340 3016

Europäisches
Patentamt

Zweigstelle
in Den Haag
Recherchen-
abteilung

European
Patent Office

Branch at
The Hague
Search
division

Office européen
des brevets

Département à
La Haye
Division de la
recherche

Hartz, Nikolai F., Dr.
Wächtershäuser & Hartz
Patentanwälte,
Tal 29
80331 München
ALLEMAGNE

EINGEGANGEN / RECEIVED
Wächtershäuser & Hartz

22 AUG. 2002

Datum/Date

22.08.02

Zeichen/Ref./Réf.

EA-PCT-11775

Anmeldung Nr./Application No./Demande n°/Patent Nr./Patent No./Brevet n°.

00957066.4-2110-JP0006165

Anmelder/Applicant/Demandeur/Patentinhaber/Propriétaire/Titulaire

KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD., et al

COMMUNICATION

The European Patent Office herewith transmits as an enclosure the European search report for the above-mentioned European patent application.

If applicable, copies of the documents cited in the European search report are attached.

☒ Additional set(s) of copies of the documents cited in the European search report is (are) enclosed as well.

REFUND OF THE SEARCH FEE

If applicable under Article 10 Rules relating to fees, a separate communication from the Receiving Section on the refund of the search fee will be sent later.





Eur pean Patent
Offic

SUPPLEMENTARY
EUROPEAN SEARCH REPORT

Application Number
EP 00 95 7066

| DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | | |
|--|--|--|--|
| Category | Citation of document with indication, where appropriate, of relevant passages | Relevant to claim | CLASSIFICATION OF THE APPLICATION (Int.Cl.7) |
| X | BARGAR T M: "A Comparative Molecular Field Analysis Study of Obtusifolioside 14alpha-methyl Demethylase Inhibitors" PESTICIDE SCIENCE, ELSEVIER APPLIED SCIENCE PUBLISHER, BARKING, GB, vol. 55, 1999, pages 1059-1069, XP002154128 ISSN: 0031-613X * abstract * * page 1066, paragraph 3.3 * Compounds 84 and 85 --- | 1-5,7 | C07D239/26 C07D239/30 C07D239/32 C07D239/34 C07D239/38 C07D239/42 C07D401/12 C07D403/06 C07D403/12 C07D405/04 C07D405/06 C07D405/12 C07D409/06 C07D409/12 C07D413/12 C07D417/12 A01N47/38 A01N43/54 |
| X | DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; TAKAMIZAWA, AKIRA: "Novel Pyrimidine derivatives" retrieved from STN Database accession no. 68:12987 XP002208031 Chemical Abstract Registry Number 7269-38-7 * abstract * & JP 42 012906 B (SHIONOGI AND CO., LTD.) 24 July 1967 (1967-07-24) --- -/-- | 1,2,4,5,7 | TECHNICAL FIELDS SEARCHED (Int.Cl.7) A01N C07D |
| The supplementary search report has been based on the last set of claims valid and available at the start of the search. | | | |
| Place of search MUNICH | | Date of completion of the search 7 August 2002 | Examiner Marie, G |
| CATEGORY OF CITED DOCUMENTS | | | |
| X: particularly relevant if taken alone Y: particularly relevant if combined with another document of the same category A: technological background O: non-written disclosure P: intermediate document | | T: theory or principle underlying the invention E: earlier patent document, but published on, or after the filing date D: document cited in the application L: document cited for other reasons ----- &: member of the same patent family, corresponding document | |



European Patent
Office

SUPPLEMENTARY
EUROPEAN SEARCH REPORT

Application Number
EP 00 95 7066

| DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | | |
|---|---|---|---|
| Category | Citation of document with indication, where appropriate, of relevant passages | Relevant to claim | CLASSIFICATION OF THE APPLICATION (Int.Cl.7) |
| X | DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BEAMAN, ALDEN G. ET AL: "Studies in the nitroimidazole series. III. 2-Nitroimidazole derivatives substituted in the 1-position" retrieved from STN Database accession no. 71:22065 XP002208032 Chemical Abstract Registry Number 22903-68-0 * abstract * & ANTIMICROB. AGENTS CHEMOTHER. (1968), VOLUME DATE 1967 520-30 , | 1,2,4,7 | A01N43/56 A01N43/66 A01N43/76 A01N43/78 A01N43/80 A01N43/82 A01N47/22 A01N47/30 A01N47/36 |
| X | DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BOVY, PHILLIPE R. ET AL: "Synthesis of heterocyclic.beta.-amino acids. A convenient preparation of.beta.-amino-5-pyrimidinepropanoic acid and derivatives." retrieved from STN Database accession no. 120:299228 XP002208033 Chemical Abstract Registry Numbers: 154844-42-5 and 154844-43-6 * abstract * & TETRAHEDRON LETT. (1993), 34(50), 8015-18 , | 1,2,6,7 | TECHNICAL FIELDS SEARCHED (Int.Cl.7) |
| The supplementary search report has been based on the last set of claims valid and available at the start of the search. | | | |
| Place of search MUNICH | | Date of completion of the search 7 August 2002 | Examiner Marie, G |
| <p>CATEGORY OF CITED DOCUMENTS</p> <p>X : particularly relevant if taken alone Y : particularly relevant if combined with another document of the same category A : technological background O : non-written disclosure P : intermediate document</p> <p>T : theory or principle underlying the invention E : earlier patent document, but published on, or after the filing date D : document cited in the application L : document cited for other reasons & : member of the same patent family, corresponding document</p> | | | |

4

PO FORM 1503 03 82 (P04C04)



European Patent
Office

SUPPLEMENTARY
EUROPEAN SEARCH REPORT

Application Number
EP 00 95 7066

| DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | | |
|--|--|---|--|
| Category | Citation of document with indication, where appropriate, of relevant passages | Relevant to claim | CLASSIFICATION OF THE APPLICATION (Int.Cl.7) |
| X | "Studies on pyrimidine derivatives and related compounds. LXXVII. Reaction of thiamine analogues with diethyl benzoylphosphonate" CHEM. PHARM. BULL., vol. 21, no. 4, 1973, pages 770-784, XP002934385 | 1,2,6,7 | |
| X | Compounds 1-6 | 6 | |
| X | Compounds 3-5 | 1,2,7 | |
| X,D | EP 0 764 641 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 26 March 1997 (1997-03-26) compounds 1-14, 1-25 to 1-27, 1-32, 1-34, 1-35, 1-40 to 1-43, 1-67, 1-113, 3-17, 3-19 in * tables 1-1,3-1 * | 6 | |
| X,D | WO 96 22980 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD ; SATOW JUN (JP); KONDO YASUO (JP); KUDO YO) 1 August 1996 (1996-08-01) * page 46-58 * See definition of R1 on page 60, compounds on lines 5-7 Page 62, compounds on lines 1, 2, 4, 6, 7 Page 75, compounds on lines 1-9 and 19, 20 ----- | 6 | |
| The supplementary search report has been based on the last set of claims valid and available at the start of the search. | | | TECHNICAL FIELDS SEARCHED (Int.Cl.7) |
| Place of search MUNICH | | Date of completion of the search 7 August 2002 | Examiner Marie, G |
| <p>CATEGORY OF CITED DOCUMENTS</p> <p>X: particularly relevant if taken alone Y: particularly relevant if combined with another document of the same category A: technological background O: non-written disclosure P: intermediate document</p> <p>T: theory or principle underlying the invention E: earlier patent document, but published on, or after the filing date D: document cited in the application L: document cited for other reasons</p> <p>&: member of the same patent family, corresponding document</p> | | | |

4

FORM 1503 03.82 (P04C04)

filed 3/11/02

filed 3/11/02

filed 3/11/02

**ANNEX TO THE EUROPEAN SEARCH REPORT
ON EUROPEAN PATENT APPLICATION NO.**

EP 00 95 7066

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned European search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on
The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information.

07-08-2002

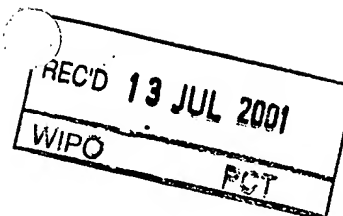
| Patent document cited in search report | | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| JP 42012906 | B | | NONE | |
| EP 0764641 | A | 26-03-1997 | AU 8004594 A | 23-05-1995 |
| | | | EP 0764641 A1 | 26-03-1997 |
| | | | US 5716904 A | 10-02-1998 |
| | | | WO 9512582 A1 | 11-05-1995 |
| | | | JP 8073441 A | 19-03-1996 |
| | | | CN 1133589 A | 16-10-1996 |
| WO 9622980 | A | 01-08-1996 | JP 11228545 A | 24-08-1999 |
| | | | AU 4496096 A | 14-08-1996 |
| | | | WO 9622980 A1 | 01-08-1996 |

14T

特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

| | | |
|--|---|-------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 KM-094-X | 今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JPO0/06165 | 国際出願日 (日.月.年) 08.09.00 | 優先日 (日.月.年) 09.09.99 |
| 国際特許分類(IPC) Int. Cl. C07D239/26, 239/32, 401/12, 403/06, C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54 | | |
| 出願人(氏名又は名称) クミアイ化学工業株式会社 | | |

| |
|--|
| 1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条(PCT36条)の規定に従い送付する。 |
| 2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>3</u> ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で _____ ページである。 |
| 3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input type="checkbox"/> 国際出願に対する意見 |

| | | |
|---|---|---------|
| 国際予備審査の請求書を受理した日 18.01.01 | 国際予備審査報告を作成した日 27.06.01 | |
| 名称及びあて先 日本国特許庁(IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官(権限のある職員) 内藤 伸一 電話番号 03-3581-1101 内線 3492 | 4P 8615 |

様式PCT/IPEA/409(表紙)(1998年7月)

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

| | | | |
|----------------|-------|--------|---|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 | 1-5, 7 | 有 |
| | 請求の範囲 | 6 | 無 |
| 進歩性 (IS) | 請求の範囲 | 1-5, 7 | 有 |
| | 請求の範囲 | 6 | 無 |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 | 1-7 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献:

- 1) EP, 764641, A1 (NISSAN CHEMICAL Ind. Ltd.) 26. 3月. 1997 (26. 03. 97)
- 2) WO, 96/22980, A1 (日産化学工業株式会社) 01. 8月. 1996 (01. 08. 96)
- 3) Chemical & Pharmaceutical Bulletin; vol. 21 (No. 4) p770-784 (1983)

請求の範囲6について:

上記文献には、請求の範囲6に包含される化合物が記載されている。

(文献1)の EXAMPLE 24の化合物、文献2)の EXAMPLE 7の化合物、文献3)の 771頁 Chart. 4の化合物1~6等参照。)

したがって、請求の範囲6は新規性及び進歩性を有さない。

請求の範囲1-5, 7について

文献1, 2には除草剤として用いられるピリミジン誘導体が記載されているが、請求の範囲1の式において、N-W-A_rで示される部分構造を有していない。

かかる構造について上記文献には示唆する記載がないので、請求の範囲1-5, 7は新規性及び進歩性を有する。

EP



PCT

特 許 協 力 条 約

国際調査報告

(法8条、法施行規則第40、41条)
(PCT18条、PCT規則43、44)

| | | |
|-----------------------------|---|-------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 KM-094-X | 今後の手続きについては、国際調査報告の送付通知様式(PCT/ISA/220) 及び下記5を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JP00/06165 | 国際出願日 (日.月.年) 08.09.00 | 優先日 (日.月.年) 09.09.99 |
| 出願人(氏名又は名称) クミアイ化学工業株式会社 | | |

国際調査機関が作成したこの国際調査報告を法施行規則第41条(PCT18条)の規定に従い出願人に送付する。
この写しは国際事務局にも送付される。

この国際調査報告は、全部で 3 ページである。

☐ この調査報告に引用された先行技術文献の写しも添付されている。

1. 国際調査報告の基礎

a. 言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願がされたものに基づき国際調査を行った。

☐ この国際調査機関に提出された国際出願の翻訳文に基づき国際調査を行った。

b. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際調査を行った。

☐ この国際出願に含まれる書面による配列表

☐ この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

☐ 出願後に、この国際調査機関に提出された書面による配列表

☐ 出願後に、この国際調査機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

☐ 書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

2. ☐ 請求の範囲の一部の調査ができない(第I欄参照)。

3. ☐ 発明の単一性が欠如している(第II欄参照)。

4. 発明の名称は ☒ 出願人が提出したものを承認する。

☐ 次に示すように国際調査機関が作成した。

5. 要約は

☒ 出願人が提出したものを承認する。

☐ 第III欄に示されているように、法施行規則第47条(PCT規則38.2(b))の規定により国際調査機関が作成した。出願人は、この国際調査報告の発送の日から1カ月以内にこの国際調査機関に意見を提出することができる。

6. 要約書とともに公表される図は、

第 _____ 図とする。 ☐ 出願人が示したとおりである。

☒ なし

☐ 出願人は図を示さなかった。

☐ 本図は発明の特徴を一層よく表している。

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D239/26, C07D29/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D239/26, C07D29/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| <u>X</u> | EP, 764641, A1 (NISSAN CHEMICAL Ind. Ltd.) 26.3月.1997(26.03.97) EXAMPLE 24の化合物参照。 | <u>6</u> |
| <u>A</u> | & WO, 95/12582, A1 & JP, 8-73441, A & US, 5716904, A & CN, 1133589, A | <u>1-5, 7</u> |
| <u>X</u> | WO, 96/22980, A1 (日産化学工業株式会社) 01.8月.1996(01.08.96) | <u>6</u> |
| <u>A</u> | EXAMPLE 7の化合物参照。 & JP, 11-228545, A | <u>1-5, 7</u> |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

04.12.00

国際調査報告の発送日

12.12.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)
横尾 俊一

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

4 P 7822

| C (続き) 関連すると認められる文献 | | |
|---------------------|---|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | TAKAMIZAWA A. et.al. "Studies on Pyrimidine Derivatives and Rerated Compounds LXXVII" Chemical & Pharmaceutical Bulletin;vol.21 (No.4) p770-784 (1983) 771頁Chart.4の化合物1～6 参照。 | 6 |

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

| | | |
|--|---|--|
| Applicant's or agent's file reference KM-094-X | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) | |
| International application No. PCT/JP00/06165 | International filing date (day/month/year) 08 September 2000 (08.09.00) | Priority date (day/month/year) 09 September 1999 (09.09.99) |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 239/26, 239/32, 401/12, 403/06, 405/04, 409/12, A01N 47/38, 43/54 | | |
| Applicant KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD. | | |

| |
|--|
| 1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36. |
| 2. This REPORT consists of a total of <u>3</u> sheets, including this cover sheet. <input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of _____ sheets. |
| 3. This report contains indications relating to the following items: I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report II <input type="checkbox"/> Priority III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application |

| | |
|--|--|
| Date of submission of the demand 18 January 2001 (18.01.01) | Date of completion of this report 27 June 2001 (27.06.2001) |
| Name and mailing address of the IPEA/JP Facsimile No. | Authorized officer Telephone No. |

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP00/06165

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
pages _____, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP00/06165

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

| | | | |
|-------------------------------|--------|-------|-----|
| Novelty (N) | Claims | 1-5,7 | YES |
| | Claims | 6 | NO |
| Inventive step (IS) | Claims | 1-5,7 | YES |
| | Claims | 6 | NO |
| Industrial applicability (IA) | Claims | 1-7 | YES |
| | Claims | | NO |

2. Citations and explanations**Documents**

- 1) EP, 764641, A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.) 26 March 1997 (26.03.97)
- 2) WO, 96/22980, A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.) 1 August 1996 (01.08.96)
- 3) Chemical & Pharmaceutical Bulletin, Vol. 21, No. 4, 1983, pp. 770-784

Claim 6

Compounds included in Claim 6 are described in the above documents (see the compound of Example 24 of document 1, the compound of Example 7 of document 2 and Compounds 1-6, Chart 4, page 771 of document 3).

Therefore, the invention set forth in Claim 6 does not appear to be novel and does not appear to involve an inventive step.

Claims 1-5 and 7

Documents 1 and 2 describe pyrimidine derivatives used as herbicides, but they do not have the partial structure represented by N-W-Ar in the formula set forth in Claim 1. Because the above documents contain no statement suggesting this structure, the inventions set forth in Claims 1-5 and 7 appear to be novel and appear to involve an inventive step.

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2001年3月15日 (15.03.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/17975 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 239/26, 239/32, 401/12, 403/06,
405/04, 409/12, A01N 47/38, 43/54

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/06165

(22) 国際出願日: 2000年9月8日 (08.09.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願平11/255029 1999年9月9日 (09.09.1999) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): クミアイ化学工業株式会社 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒110-0008 東京都台東区池之端1丁目4番26号 Tokyo (JP). イハラケミカル工業株式会社 (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒110-0008 東京都台東区池之端1丁目4番26号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 安田厚司 (YASUDA, Atsushi) [JP/JP]; 〒277-0843 千葉県柏市明原4丁目9番地の15 Chiba (JP). 高部文明 (TAKABE, Fumiaki) [JP/JP]. 山口幹夫 (YAMAGUCHI, Mikio) [JP/JP]; 〒437-1213 静岡県磐田郡福田町塩新田 408 番地の1 株式会社 ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 漆畑育巳 (URUSHIBATA, Ikumi) [JP/JP]; 〒277-0885 千葉県柏市西原1丁目18番地の6 Chiba (JP). 山地充洋

(YAMAJI, Yoshihiro) [JP/JP]. 藤波 周 (FUJINAMI, Makoto) [JP/JP]; 〒439-0031 静岡県小笠郡菊川町加茂 1809 番地 Shizuoka (JP). 宮沢武重 (MIYAZAWA, Takeshige) [JP/JP]; 〒437-1403 静岡県小笠郡大東町岩滑 1205-9 Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 泉名謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

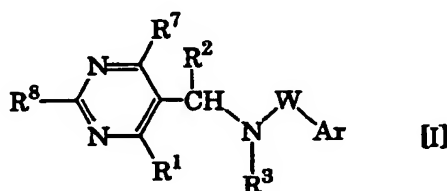
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PYRIMIDINE DERIVATIVES AND HERBICIDES CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: ピリミジン誘導体及びそれを含有する除草剤

(57) Abstract: Pyrimidine derivatives represented by general formula (I) which have an excellent herbicidal activity and a selectivity on crops from weeds, and herbicides containing these pyrimidine derivatives as the active ingredient. In said formula, R¹ represents hydrogen, alkyl, haloalkyl, etc.; R² represents alkyl, optionally substituted phenyl, etc.; R³ represents hydrogen, alkyl, alkynyl, etc.; R⁷ represents hydrogen, halogeno, alkyl, etc.; R⁸ represents hydrogen, alkyl, etc.; W represents -C(=Q)Z- or -SO₂- (wherein Q represents O or S; and Z represents O, S, -C(R⁴)R⁵, NR⁶, etc. (wherein R⁴ and R⁵ represent each hydrogen, alkyl, alkoxy, etc.; and R⁶ represents hydrogen or alkyl;)); and Ar represents optionally substituted phenyl, optionally substituted pyridyl, etc.

[続葉有]

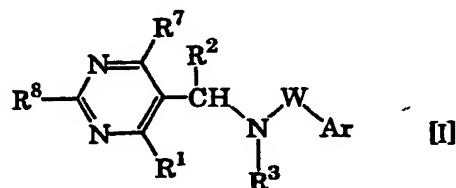
NOTED 40804001

WO 01/17975 A1



(57) 要約:

有用作物に対して、優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性を有するピリミジン誘導体を提供する。以下の一般式 [I]



(式中、 R^1 は水素原子、アルキル基又はハロアルキル基等； R^2 はアルキル基又は置換可フェニル基等； R^3 は水素原子、アルキル基又はアルキニル基等； R^7 は水素原子、ハロゲン原子又はアルキル基等； R^8 は水素原子、アルキル基等； W は基- $\text{C}(=\text{Q})\text{Z}$ -又は基- SO_2 -； Q は O 又は S ； Z は O 、 S 、基- $\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5$ -,又は基- NR^6 等； R^4 及び R^5 は水素原子、アルキル基又はアルコキシ基等； R^6 は水素原子又はアルキル基； Ar 基は置換可フェニル基又は置換可ピリジル基等) で表されるピリミジン誘導体及び該ピリミジン誘導体を有効成分として含有する除草剤。

明細書

ピリミジン誘導体及びそれを含有する除草剤

技術分野

本発明は、新規なピリミジン誘導体及びこれを有効成分として含有する除草剤に関するものである。

背景技術

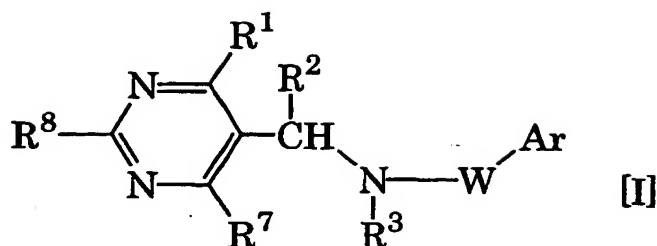
ピリミジン誘導体については、国際出願 WO95/12582 号公報明細書、国際出願 WO96/22980 号公報明細書、国際出願 WO97/12877 号公報明細書等に知られているが、本発明のピリミジン誘導体は未だ知られていない。

有用作物に対して使用される除草剤は、畑作土壌又は水田に施用し、低薬量で十分な除草効果を示し、しかも作物・雑草間の選択性を発揮する薬剤であることが望まれる。そこで本発明は優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性のある化合物を提供することを課題とする。

発明の開示

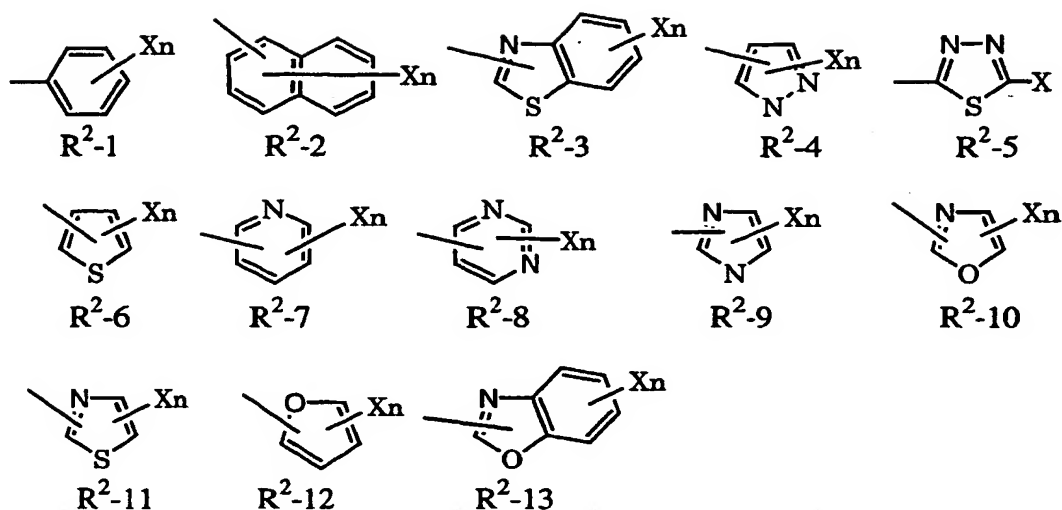
本発明者らは、このような状況に鑑み種々の置換ピリミジン誘導体を合成し、その生理活性について検討を重ねた。その結果、本発明化合物の新規な置換ピリミジン誘導体が優れた除草活性ならびに作物雑草間に選択性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は、一般式 [I]



〔式中、 R^1 は水素原子（但し R^2 =水素原子であり $W=SO_2$ の場合は除く）、ハロゲン原子、 $C1\sim C6$ アルキル基、 $C1\sim C6$ アルキルカルボニル $C1\sim C6$ アルキル基、ヒドロキシ基、 $C2\sim C6$ アルケニル基、 $C2\sim C6$ アルキニル基、 $C3\sim C6$ シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、 $C1\sim C6$ アルキル基、 $C1\sim C6$ アルコキシ基又は $C1\sim C4$ ハロアルキル基により置換されてもよい。）、 $C1\sim C4$ ハロアルキル基、 $C1\sim C6$ アルコキシ基、 $C1\sim C4$ ハロアルコキシ基、 $C2\sim C6$ アルケニルオキシ基、 $C2\sim C6$ アルキニルオキシ基、 $C3\sim C6$ シクロアルキルオキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、 $C1\sim C6$ アルキル基、 $C1\sim C6$ アルコキシ基、 $C1\sim C4$ ハロアルキル基、 $C1\sim C4$ ハロアルコキシ基、シアノ基、シアノ $C1\sim C6$ アルキル基、ニトロ基、 $C1\sim C6$ アルキルチオ基、 $C1\sim C6$ アルキルスルフィニル基又は $C1\sim C6$ アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、 $C1\sim C6$ アルキルチオ基（但し R^2 =フェニル基であり $W=SO_2$ の場合は除く）、 $C2\sim C6$ アルケニルチオ基、 $C2\sim C6$ アルキニルチオ基、 $C3\sim C6$ シクロアルキルチオ基、 $C1\sim C6$ アルキルスルフィニル基、 $C2\sim C6$ アルケニルスルフィニル基、 $C2\sim C6$ アルキニルスルフィニル基、 $C3\sim C6$ シクロアルキルスルフィニル基、 $C1\sim C6$ アルキルスルホニル基、 $C2\sim C6$ アルケニルスルホニル基、 $C2\sim C6$ アルキニルスルホニル基、 $C3\sim C6$ シクロアルキルスルホニル基、 $C1\sim C6$ ヒドロキシアルキル基、 $C2\sim C7$ アシル基、 $C1\sim C6$ アルコキシ $C1\sim C6$ アルキル基、シアノ基、 $C1\sim C6$ アルコキシカルボニル基、 $C1\sim C6$ アルコキシカルボニル $C1\sim C6$ アルキル基、 $C1\sim C6$ アルコキシカルボニル $C2\sim C6$ アルケニル基、カルボキシ基、カルボキシ $C1\sim C6$ アルキル基、ジ $C1\sim C6$ アルコキシ $C1\sim C6$ アルキル基、 $C1\sim C6$ アルコキシイミノ $C1\sim C6$ アルキル基、ヒドロキイミノ $C1\sim C6$ アルキル基、ジオキサニル基（該基は $C1\sim C6$ アルキル基が置換されてもよい）、ア

ルデヒド基、オキシラニル基、基 NR^9R^{10} 又は基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ を表し、 R^9 は水素原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}3\sim\text{C}6$ シクロアルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}7$ アシル基又は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルスルホニル基を表し、 R^{10} は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}3\sim\text{C}6$ シクロアルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}7$ アシル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルスルホニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシカルボニル基、又はベンジルオキシカルボニル基を表し、ここで R^9 及び R^{10} はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員飽和環を形成してもよく、 R^2 は水素原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ基、 $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}3\sim\text{C}6$ シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ基又は $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルキル基により置換されてもよい。）、 $\text{C}2\sim\text{C}7$ アシル基、シアノ基、ジ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシイミノ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、ヒドロキシイミノ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、ジオキシラニル基（該基は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基が置換されてもよい）、シアノ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ ヒドロキシアルキル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシカルボニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシカルボニル $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 又は一般式 $\text{R}^2\text{-1}\sim\text{R}^2\text{-13}$



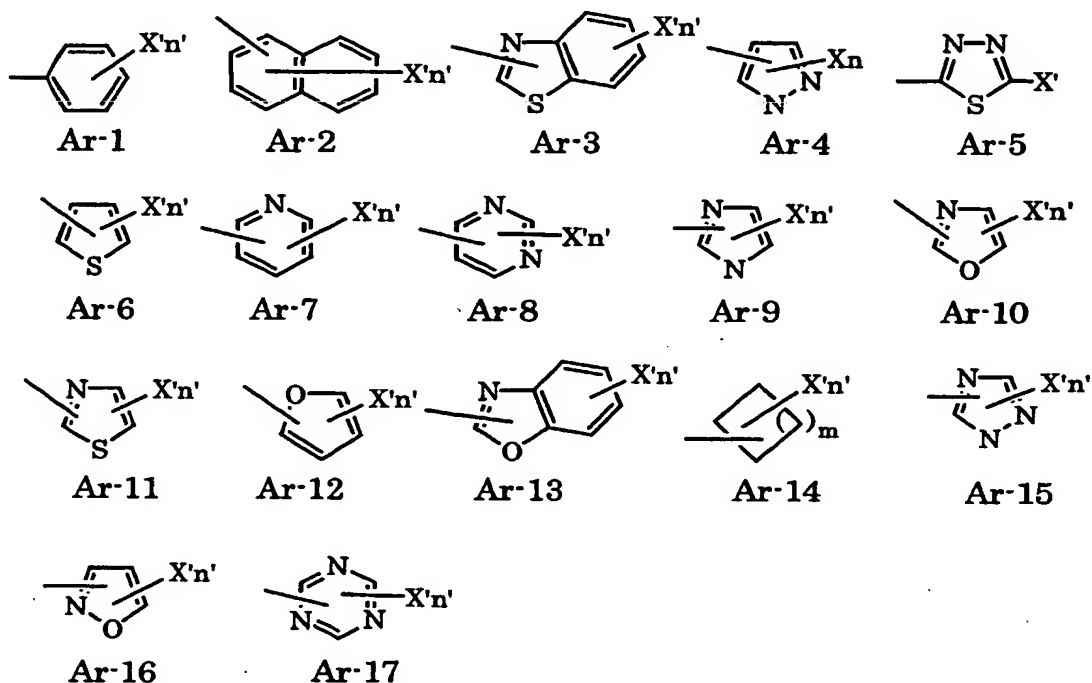
(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、 R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R^3 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、ジ C1～C6 アルキルアミノ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル C1～C6 アルキル基、オキシラニル C1～C6 アルキル基又は C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基を表し、

W は基 $-C(=Q)Z-$ 又は基 $-SO_2-$ を表し、Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、Z は酸素原子、硫黄原子、基 $-NR^6-$ 、基 $-CH_2CH_2-$ 、基 $-CH=CH-$ 、基 $-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(R^4)R^5-Q-$ 、基 $-Q-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(=Q)-$ 、基 $-NR^6$

NR^{6a}—又は基—NR⁶C(R⁴)R⁵—を表し、R⁴及びR⁵は水素原子、C1～C6 アルキル基、ハロゲン原子、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C6 アルキルチオ基を表し、R⁶ 及び R^{6a}は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基又は C2～C6 アルキニル基を表し、ここで R³ 及び R⁶ はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員環状ウレアを形成してもよく、

Ar 基は一般式 Ar-1～Ar-17



(式中、X'は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR⁹R¹⁰、基 CONR⁹R¹⁰、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n'は 1～3 の整数を表し、m は 0～3 の整数を表し、n'が 2～3 の整数の場合は、X'は、同一でも異なってもよく、又、隣接した低級ア

ルコキシ基同士が 2 個結合して C1~C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、

R⁷は水素原子、ハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又は C3~C6 シクロアルキル基を表し、

R⁸は水素原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又は C3~C6 シクロアルキル基を表す。| で示されるピリミジン誘導体及び、これを有効成分として含有する除草剤を提供するものである。

尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

C1~C6 アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が 1~6 の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基又は *tert*-ブチル基等を挙げることができる。

C3~C6 シクロアルキル基とは、炭素数が 3~6 のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基等を挙げることができる。

C2~C6 アルケニル基とは、炭素数が 2~6 の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエテニル基又は 2-プロペニル基等を挙げることができる。

C2~C6 アルキニル基とは、炭素数が 2~6 の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えばエチニル基又は 2-プロピニル基等を挙げることができる。

C1~C4 ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、同一又は相異なるハロゲン原子 1~9 で置換されている炭素数が 1~4 の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えばクロロメチル基、トリフルオロメチル基又はテトラフルオロエチル基等を挙げることができる。

C1~C6 アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である (アルキル) -O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基又はプロポキシ基等を挙げることができる。

C2~C6 アルケニルオキシ基とは、アルケニル部分が上記の意味である (アル

ケニル) -O-基を示し、例えばエテニルオキシ基又は 2-プロペニルオキシ基等を挙げることができる。

C2~C6 アルキニルオキシ基とは、アルキニル部分が上記の意味である (アルキニル) -O-基を示し、例えばエチニルオキシ基又は 2-プロピニルオキシ基等を挙げることができる。

C3~C6 シクロアルキルオキシ基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である (シクロアルキル) -O-基を示し、例えばシクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基又はシクロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基とは、アルキル部分が上記の意味である (アルキル) -O- (アルキレン) -基を示し、例えばメトキシメチル基又はエトキシメチル基等を挙げることができる。

C3~C6 シクロアルキル C1~C6 アルキル基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である (シクロアルキル) - (C1~C6 アルキレン) 基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基又はシクロヘキシルエチル基等を挙げることができる。

C1~C4 ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である (ハロアルキル) -O-基を示し、例えばトリフルオロメトキシ基又は 2,2,2-トリフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

C1~C6 アルキルチオ基、C1~C6 アルキルスルフィニル基及び C1~C6 アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である (アルキル) -S-基、(アルキル) -SO-基、(アルキル) -SO₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、メチルスルホニル基又はエチルスルホニル基等を挙げることができる。

C2~C6 アルケニルチオ基、C2~C6 アルケニルスルフィニル基及び C2~C6 アルケニルスルホニル基とは、アルケニル部分が上記の意味である (アルケニル) -S-基、(アルケニル) -SO-基、(アルケニル) -SO₂-基を示し、例えばプロペニルチオ基、ブテニルチオ基、プロペニルスルフィニル基、ブテニルスルフィニル基、プロペニルスルホニル基又はブテニルスルホニル基等を挙げることができる。

C2~C6 アルキニルチオ基、C2~C6 アルキニルスルフィニル基及び C2~C6 アルキニルスルホニル基とは、アルキニル部分が上記の意味である（アルキニル）-S-基、（アルキニル）-SO-基、（アルキニル）-SO₂-基を示し、例えばエチニルチオ基、2-プロピニルチオ基、エチニルスルフィニル基、2-プロピニルスルフィニル基、エチニルスルホニル基又は 2-プロピニルスルホニル基等を挙げることができる。

C3~C6 シクロアルキルチオ基、C3~C6 シクロアルキルスルフィニル基及び C3~C6 シクロアルキルスルホニル基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である（シクロアルキル）-S-基、（シクロアルキル）-SO-基、（シクロアルキル）-SO₂-基を示し、例えばシクロプロピルチオ基、シクロブチルチオ基、シクロペンチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、シクロプロピルスルフィニル基、シクロブチルスルフィニル基、シクロペンチルスルフィニル基、シクロヘキシルスルフィニル基、シクロプロピルスルホニル基、シクロブチルスルホニル基、シクロペンチルスルホニル基又はシクロヘキシルスルホニル基等を挙げることができる。

C1~C6 アルキルチオ C1~C6 アルキル基とは、アルキル部分が上記の意味である（アルキル）-S-（アルキレン）基を示し、例えばメチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基又はメチルチオエチル基等を挙げることができる。

C2~C7 アシル基とは、C1~C6 アルキルカルボニル基、C2~C6 アルケニルカルボニル基、C2~C6 アルキニルカルボニル基、C3~C6 シクロアルキルカルボニル基又はベンゾイル基を示し、例えばアセチル基、プロピオニル基、n-ブチリル基、イソブチリル基、シクロプロピルカルボニル基又はベンゾイル基等を挙げることができる。

C1~C6 アルキルカルボニル C1~C6 アルキル基とは例えばメチルカルボニルメチル基、エチルカルボニルメチル基又はプロピルカルボニルメチル基等を挙げることができる。

ジ C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基とは、例えばジメトキシメチル基又はジエトキシメチル基等を挙げることができる。

C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基とは、例えばメトキイミノメチル基、エトキシイミノメチル基等を挙げることができる。

ヒドロキシイミノ C1～C6 アルキル基とは、例えばヒドロキシイミノメチル基又はヒドロキシイミノエチル基等を挙げることができる。

シアノ C1～C6 アルキル基とは、例えばシアノメチル基又はシアノエチル基等が挙げられる。

C1～C6 ヒドロシアルキル基とは、例えばヒドロキシメチル基又はヒドロキシエチル基等が挙げられる。

C1～C6 アルコシカルボニル基とは、例えばメトキカルボニル基又はエトシカルボニル基等を挙げることができる。

C1～C6 アルコシカルボニル C1～C6 アルキル基とは、例えばメトキカルボニルメチル基又はエトシカルボニルメチル基等を挙げることができる。

カルボキシル C1～C6 アルキル基とは、例えばカルボキシメチル基又はカルボキシエチル基等を挙げることができる。

ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基とは、例えばジエトキシメチル基又はジメトキシエチル基等を挙げることができる。

ジ C1～C6 アルキルアミノ基とはアルキルアルキル部分が上記の意味であるジアルキルアミノ基であり、例えばジメチルアミノ基又はジエチルアミノ基等を挙げることができる。

発明を実施するための最良の形態

次に、一般式 [I] で表される本発明化合物の代表的な具体例を表 1～表 39 に例示する。しかしながら、本発明化合物はこれらの化合物に限定されるものではない。尚、化合物番号は以後の記載において参照される。また、本発明化合物及び記載化合物中で 1 つ以上の不斉炭素を有している場合は全ての立体異性体を本発明化合物として含む。

本明細書の表中において S-体及び R-体の表記はそれぞれ光学異性体の S-体及び R-体を表し、不斉炭素を有していても特に表記がない場合はラセミ体を表す。また、表中において A-体及び B-体の表記は、ジアステレマー異性体が存在する場

合、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで分割して先に溶出するものを A-体、後に溶出するものを B-体とし、ジアステレオマー異性体が存在していても特に表記がない場合はジアステレオマー混合物を表す。

本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

| | | | |
|-------|--------------|-------|-------------|
| Me | : メチル基、 | Et | : エチル基、 |
| Pr | : n-プロピル基、 | Pr-i | : イソプロピル基、 |
| Pr-c | : シクロプロピル基、 | Bu | : n-ブチル基、 |
| Bu-i | : イソブチル基、 | Bu-s | : sec-ブチル基、 |
| Bu-t | : tert-ブチル基、 | Bu-c | : シクロブチル基、 |
| Pen | : n-ペンチル基、 | Pen-i | : イソペンチル基、 |
| Pen-c | : シクロペンチル基、 | Hex-c | : シクロヘキシル基 |

表 1

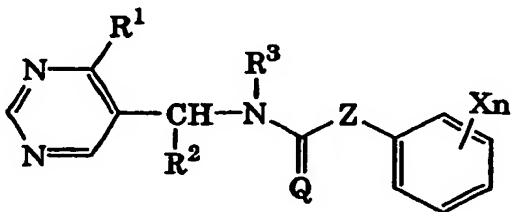
|  | | | | | | | | |
|--|-------------------|----------------|----------------|-----------------|-------------------|---|----------|--|
| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Xn | Q | ジアステレオマー | 融点(℃)または屈折率(n _D ²⁰) |
| 1-1 | CClF ₂ | Pr-c | H | CH ₂ | H | O | | 124-127 |
| 1-2 | CClF ₂ | Pr-c | H | CH ₂ | 4-OMe | O | | 116-119 |
| 1-3 | CClF ₂ | Pr-c | H | CH ₂ | 4-Cl | O | | 125-128 |
| 1-4 | CClF ₂ | Pr-c | H | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 111-114 |
| 1-5 | CF ₃ | Pr-i | H | CH ₂ | H | O | | 144-146 |
| 1-6 | CF ₃ | Pr-i | H | CH ₂ | 4-OMe | O | | 114-117 |
| 1-7 | CF ₃ | Pr-i | H | CH(Me) | H | O | | 1.5163 |
| 1-8 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 106-109 |
| 1-9 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OMe | O | | 1.5289 |
| 1-10 | CF ₃ | Pr-i | Me | S | H | O | | 131-133 |
| 1-11 | CF ₃ | Pr-i | Me | S | 4-OMe | O | | 156-159 |
| 1-12 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 109-110 |
| 1-13 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OEt | O | | 1.5151 |
| 1-14 | CF ₃ | Pr-i | Me | S | 4-Cl | O | | |
| 1-15 | CClF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 109-112 |
| 1-16 | CClF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OMe | O | | 測定不可 |
| 1-17 | CClF ₂ | Pr-i | Me | S | H | O | | 127-130 |
| 1-18 | CClF ₂ | Pr-i | Me | S | 4-OMe | O | | 136-139 |
| 1-19 | CClF ₂ | Pr-i | Me | O | H | O | | 115-118 |
| 1-20 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-Cl | O | | 178-181 |
| 1-21 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Cl | O | | 122-125 |
| 1-22 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 98-101 |
| 1-23 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 76-79 |
| 1-24 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 105-108 |
| 1-25 | CClF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 126-129 |
| 1-26 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | H | O | | 87-90 |
| 1-27 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-F | O | | 130-132 |
| 1-28 | CF ₃ | Pr-i | Me | NH | H | O | | 149-150 |
| 1-29 | CF ₃ | Pr-i | Me | NH | 4-Cl | O | | |

表 2

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-------------------|----------------|----------------|-------------------|---------------------|---|----------|--|
| 1-30 | CF ₃ | Me | Me | CH ₂ | H | O | | 15258 |
| 1-31 | CF ₃ | Me | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 15202 |
| 1-32 | CF ₃ | Et | Me | CH ₂ | H | O | | 40-41 |
| 1-33 | CF ₃ | Et | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 72-73 |
| 1-34 | CF ₃ | Pr-c | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |
| 1-35 | CF ₃ | Pr-c | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 97-99 |
| 1-36 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 93-94 |
| 1-37 | CClF ₂ | Pr-i | Me | NH | 4-Me | O | | 135-137 |
| 1-38 | CClF ₂ | Pr-i | Me | NH | H | O | | 146-147 |
| 1-39 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | 119-120 |
| 1-40 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,5-F ₂ | O | | 145-146 |
| 1-41 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | 93-95 |
| 1-42 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-I | O | | 102-104 |
| 1-43 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Bu-t | O | | 101-102 |
| 1-44 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-SMe | O | | 69-71 |
| 1-45 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-Cl ₂ | O | | 145-146 |
| 1-46 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 115-116 |
| 1-47 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-OMe,4-Cl | O | | 129-131 |
| 1-48 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | 120-123 |
| 1-49 | CF ₃ | Pr-i | Pr | CH ₂ | 4-Cl | O | | 140-141 |
| 1-50 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-Me | O | | 154-155 |
| 1-51 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Me | O | | 93-94 |
| 1-52 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-NO ₂ | O | | 146-149 |
| 1-53 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 91-92 |
| 1-54 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 111-112 |
| 1-55 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 84-87 |
| 1-56 | CH ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 118-119 |
| 1-57 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | H | O | | 70-71 |
| 1-58 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 84-85 |
| 1-59 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 73-75 |
| 1-60 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 61-64 |
| 1-61 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | 92-94 |
| 1-62 | CF ₃ | Pr-i | Pr | CH ₂ | 4-Me | O | | 83-86 |
| 1-63 | CF ₃ | Pr-i | Pr | CH ₂ | H | O | | 146-147 |
| 1-64 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | H | O | | 117-119 |
| 1-65 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 4-Cl | O | | 141-142 |

表 3

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-------------------|----------------|----------------|---------------------------------|-----------------------|---|----------|--|
| 1-66 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 120-123 |
| 1-67 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Et | O | | 56-58 |
| 1-68 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Pr-i | O | | 86-87 |
| 1-69 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ S | H | O | | |
| 1-70 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Br | O | | 120-121 |
| 1-71 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5232 |
| 1-72 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | 83-85 |
| 1-73 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ S | 4-Cl | O | | |
| 1-74 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-NO ₂ | O | | 118-121 |
| 1-75 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CN | O | | 141-142 |
| 1-76 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CH ₂ OMe | O | | 58-60 |
| 1-77 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ CH ₂ | H | O | | 79-82 |
| 1-78 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 110-113 |
| 1-79 | Pr-i | Me | Me | CH ₂ | H | O | | 69-70 |
| 1-80 | CF ₃ | Pr-i | Pr-c | CH ₂ | H | O | | 83-86 |
| 1-81 | CF ₃ | Pr-i | Pr-c | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5297 |
| 1-82 | CF ₃ | Pr-i | Pr-c | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5219 |
| 1-83 | CF ₃ | Pr-i | Pr-c | CH ₂ | 4-F | O | | 81-84 |
| 1-84 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-C≡CMe | O | | 128-132 |
| 1-85 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH=CH | H | O | | 1.5375 |
| 1-86 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH=CH | 4-Cl | O | | 1.5565 |
| 1-87 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 80-83 |
| 1-88 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 102-104 |
| 1-89 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 106-107 |
| 1-90 | H | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5503 |
| 1-91 | CClF ₂ | Pr-c | Me | CH ₂ | H | O | | 111-113 |
| 1-92 | CClF ₂ | Pr-c | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 91-92 |
| 1-93 | CClF ₂ | Pr-c | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 87-88 |
| 1-94 | CClF ₂ | Pr-c | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 112-114 |
| 1-95 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OCF ₃ | O | | 80-81 |
| 1-96 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OCHF ₂ | O | | 54-57 |
| 1-97 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OPr-i | O | | 74-75 |
| 1-98 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-CN | O | | 139-142 |
| 1-99 | CF ₃ | Pr-i | Pr | CH ₂ | 4-CN | O | | 162-163 |
| 1-100 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F | O | | 163-164 |
| 1-101 | Pr-c | Pr-i | M | CH ₂ | 4-F | O | | 111-112 |

表 4

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------|----------------|---------------------|-------------------|----------------------|---|----------|--|
| 1-102 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 81-83 |
| 1-103 | CF ₃ | Pr-i | Pr-i | CH ₂ | H | O | | 1.5131 |
| 1-104 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-SO ₂ Me | O | | 137-139 |
| 1-105 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ OMe | CH ₂ | 4-Cl | O | | 142-145 |
| 1-106 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ OMe | CH ₂ | 4-Me | O | | 104-106 |
| 1-107 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ OEt | CH ₂ | 4-Me | O | | 91-94 |
| 1-108 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-F | O | | |
| 1-109 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Me | O | | |
| 1-110 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Cl | O | | |
| 1-111 | CF ₃ | Pr | Me | CH ₂ | H | O | | 54-55 |
| 1-112 | CF ₃ | Pr | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 67-70 |
| 1-113 | CF ₃ | Pr | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 63-64 |
| 1-114 | CF ₃ | Pr | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 91-92 |
| 1-115 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me)O | H | O | | 127-130 |
| 1-116 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me)O | 4-Cl | O | | 104-105 |
| 1-117 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me)O | 4-Me | O | | |
| 1-118 | CF ₃ | Pr-i | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5028 |
| 1-119 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-OMe,4-Me | O | | 1.5109 |
| 1-120 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Me,4-Cl | O | | 92-94 |
| 1-121 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Cl,4-Me | O | | 121-122 |
| 1-122 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | 135-136 |
| 1-123 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,6-F ₂ | O | | 176-177 |
| 1-124 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-Cl ₂ | O | | 147-149 |
| 1-125 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 2-F | O | | 157-158 |
| 1-126 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 3-F | O | | 127-128 |
| 1-127 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 4-F | O | | 119-121 |
| 1-128 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 118-119 |
| 1-129 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 125-126 |
| 1-130 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 123-126 |
| 1-131 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 110-113 |
| 1-132 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 2-Cl | O | | 162-163 |
| 1-133 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 3-Cl | O | | 122-124 |
| 1-134 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 2-Me | O | | 136-138 |
| 1-135 | CF ₃ | Pr-i | M | CH ₂ O | 3-Me | O | | 117-119 |
| 1-136 | CF ₃ | Pr-i | M | CH ₂ O | 4-Me | O | | 140-141 |
| 1-137 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | H | O | | 72-74 |

表 5

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|------------------|----------------|----------------------|-----------------|---------------------------|---|----------|--|
| 1-138 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 97-99 |
| 1-139 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 55-57 |
| 1-140 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | 69-71 |
| 1-141 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 76-78 |
| 1-142 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | S | | 93-94 |
| 1-143 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | S | | 103-104 |
| 1-144 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | S | | 92-93 |
| 1-145 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | S | | 1.5541 |
| 1-146 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(OCH ₂ O-) | O | | 82-85 |
| 1-147 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | 137-139 |
| 1-148 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,3-F ₂ | O | | 183-184 |
| 1-149 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,3,4-F ₃ | O | | |
| 1-150 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 88-89 |
| 1-151 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 125-127 |
| 1-152 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 121-124 |
| 1-153 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 78-79 |
| 1-154 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(SMe) | 4-Cl | O | | 148-149 |
| 1-155 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(OMe) | 4-Cl | O | | 107-108 |
| 1-156 | CF ₃ | Pen-c | Me | CH ₂ | 2-F | O | | 111-112 |
| 1-157 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-N(Me) ₂ | O | | 109-111 |
| 1-158 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 85-86 |
| 1-159 | CH ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | H | O | | 93-95 |
| 1-160 | CH ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 96-98 |
| 1-161 | CH ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 107-109 |
| 1-162 | CH ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 84-85 |
| 1-163 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 62-65 |
| 1-164 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 82-84 |
| 1-165 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 85-87 |
| 1-166 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 83-84 |
| 1-167 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | 156-157 |
| 1-168 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | H | O | | 85-86 |
| 1-169 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-F | O | | 100-103 |
| 1-170 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | 114-117 |
| 1-171 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | 91-92 |
| 1-172 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 124-128 |

表 6

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-------------------|----------------|----------------------|--------------------|-------------------|---|----------|--|
| 1-173 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 3-F | O | | 119-121 |
| 1-174 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 100-101 |
| 1-175 | CF ₃ | Pr-i | Me | C(Me) ₂ | 4-Me | O | | 108-110 |
| 1-176 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | H | O | | 80-81 |
| 1-177 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-F | O | | 110-112 |
| 1-178 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Cl | O | | 112-115 |
| 1-179 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Me | O | | 94-97 |
| 1-180 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F, 4-Cl | O | | 120-124 |
| 1-181 | CF ₃ | Pr-i | Pr | CH ₂ | 4-F | O | | 126-127 |
| 1-182 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ S | H | O | | 105-108 |
| 1-183 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ S | 4-Cl | O | | 111-113 |
| 1-184 | CClF ₂ | Pr-i | Me | O | 4-F | O | | 119-123 |
| 1-185 | CClF ₂ | Pr-i | Me | O | 4-Cl | O | | 99-103 |
| 1-186 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | H | O | | 86-87 |
| 1-187 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 146-147 |
| 1-188 | Bu-t | Me | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5511 |
| 1-189 | Bu-t | Me | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 88-89 |
| 1-190 | Bu-t | Me | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5532 |
| 1-191 | Bu-t | Me | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5471 |
| 1-192 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-OMe | O | | 1.5135 |
| 1-193 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 117-121 |
| 1-194 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | 119-121 |
| 1-195 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | 測定不可 |
| 1-196 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | H | O | | 107-109 |
| 1-197 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 151-154 |
| 1-198 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | 1.4992 |
| 1-199 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-200 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 120-121 |
| 1-201 | SMe | Bu-t | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-202 | SMe | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-203 | SMe | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-204 | SMe | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-205 | SMe | Ph | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-206 | SMe | Ph | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-207 | SMe | Ph | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-208 | SMe | Ph | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |

表 7

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---|----------|--|
| 1-209 | Pr-i | Bu-t | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-210 | Pr-i | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-211 | Pr-i | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-212 | Pr-i | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-213 | Pr-i | Ph | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-214 | Pr-i | Ph | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 90-91 |
| 1-215 | Pr-i | Ph | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-216 | Pr-i | Ph | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-217 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH ₂ | H | O | | 111-112 |
| 1-218 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 99-101 |
| 1-219 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 137-139 |
| 1-220 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 132-134 |
| 1-221 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH ₂ | H | O | | 136-137 |
| 1-222 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 114-115 |
| 1-223 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-224 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-225 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5566 |
| 1-226 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5549 |
| 1-227 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-228 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5531 |
| 1-229 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-230 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-231 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-232 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-233 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-234 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 99-103 |
| 1-235 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-236 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-237 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-238 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-239 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-240 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-241 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-242 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-243 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-244 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |

表 8

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|------------------|----------------|----------------|-----------------|-----------------------|---|----------|--|
| 1-245 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-246 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-247 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-248 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | |
| 1-249 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 101-103 |
| 1-250 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 170-173 |
| 1-251 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 84-85 |
| 1-252 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | |
| 1-253 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | |
| 1-254 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 141-142 |
| 1-255 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | |
| 1-256 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | |
| 1-257 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-258 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-259 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-260 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-261 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-262 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-263 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-264 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,4-(Me) ₂ | O | | |
| 1-265 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 103-104 |
| 1-266 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 88-90 |
| 1-267 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 85-87 |
| 1-268 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | |
| 1-269 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | |
| 1-270 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 151-153 |
| 1-271 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | |
| 1-272 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-F | O | | |
| 1-273 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | 137-140 |
| 1-274 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | 107-110 |
| 1-275 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-276 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-277 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-278 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-279 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-280 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |

表 9

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Xn | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|------------------|----------------|----------------|-----------------|--------------------|---|----------|--|
| 1-281 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-282 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-283 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-284 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-285 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-286 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-287 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-288 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-F,4-Cl | O | | |
| 1-289 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-290 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-291 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-292 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-293 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-294 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-295 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-296 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-297 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-298 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-299 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-300 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-301 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-302 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-303 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-304 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3,5-F ₂ | O | | |
| 1-305 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 85-87 |
| 1-306 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 92-93 |
| 1-307 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 123-125 |
| 1-308 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | |
| 1-309 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | |
| 1-310 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | 139-140 |
| 1-311 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | |
| 1-312 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ | O | | |
| 1-313 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-314 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-315 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-316 | CHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |

表 10

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------|----------------|----------------|--------------------|-------------------|---|----------|--|
| 1-317 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-318 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-319 | Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-320 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-CF ₃ | O | | |
| 1-321 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 2-F,4-Cl | O | | 144-146 |
| 1-322 | Ph | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 82-84 |
| 1-323 | Ph | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 104-105 |
| 1-324 | Ph | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 88-90 |
| 1-325 | Ph | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 79-80 |
| 1-326 | Pr-i | Pr-i | Me | NH | H | O | | 199-200 |
| 1-327 | Pr-i | Pr-i | Me | N(Me) | H | O | | 1.5384 |
| 1-328 | CF ₃ | Pr-i | Me | C(=O) | H | O | | 101-102 |
| 1-329 | CF ₃ | Pr-i | Me | C(Me) ₂ | 4-Cl | O | | 測定不可 |
| 1-330 | CF ₃ | Bu-i | Me | CH ₂ | H | O | | 86-87 |
| 1-331 | CF ₃ | Bu-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 97-98 |
| 1-332 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | H | O | | 1.5071 |
| 1-333 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | 4-F | O | | 59-62 |
| 1-334 | CF ₃ | Bu-i | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 93-94 |
| 1-335 | CF ₃ | Pr-i | Me | C(=O) | 4-Cl | O | | 116-119 |
| 1-336 | Pr-i | Ph | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-337 | CF ₃ | Ph(4-F) | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-338 | CF ₃ | Ph(4-F) | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-339 | CF ₃ | Ph(4-F) | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-340 | CF ₃ | Ph(4-F) | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-341 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-342 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-343 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-344 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-345 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-346 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-347 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-348 | CF ₃ | Ph(4-Me) | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-349 | CF ₃ | 3-thienyl | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-350 | CF ₃ | 3-thienyl | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-351 | CF ₃ | 3-thienyl | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-352 | CF ₃ | 3-thienyl | Et | CH ₂ | 4-M | O | | |

表 11

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---|----------|--|
| 1-353 | CF ₃ | 2-thienyl | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-354 | CF ₃ | 2-thienyl | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-355 | CF ₃ | 2-thienyl | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-356 | CF ₃ | 2-thienyl | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-357 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Et | CH ₂ | H | O | | |
| 1-358 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-359 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-360 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-361 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-362 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-363 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-364 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-365 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-366 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-367 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-368 | CF ₃ | Ph(4-F) | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-369 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-370 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-371 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-372 | CF ₃ | Ph(4-Cl) | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-373 | Pr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-374 | Pr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-375 | Pr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-376 | Pr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-377 | SMe | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-378 | SMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-379 | SMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-380 | SMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-381 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-382 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-383 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-384 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-385 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-386 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-387 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-388 | CF ₃ | Ph(3-Cl) | M | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-389 | Me | Bu-t | Me | CH(Me) | H | O | | |

表 12




| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(°C) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------|--|----------------|-----------------|----------------------|---|----------|---|
| 1-390 | Me | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-391 | Me | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-392 | Me | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-393 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-394 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-395 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-396 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-397 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-398 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-399 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-400 | CF ₃ | 2-thienyl | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-401 | OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5439 |
| 1-402 | OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5332 |
| 1-403 | OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 79-82 |
| 1-404 | OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 88-90 |
| 1-405 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | H | O | | |
| 1-406 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-407 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5159 |
| 1-408 | CF ₃ | Pr-i | OMe | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-409 | CF ₃ | 1-MePr-c | Me | CH ₂ | H | O | | 78-79 |
| 1-410 | CF ₃ |  Me | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 85-87 |
| 1-411 | CF ₃ |  Me | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 110-111 |
| 1-412 | CF ₃ |  Me | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 88-89 |
| 1-413 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 65-66 |
| 1-414 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 94-95 |
| 1-415 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 4-Br | O | | 109-110 |
| 1-416 | CF ₃ | CH(Me)SMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 118-119 |
| 1-417 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,3,4-F ₃ | O | | 167-169 |
| 1-418 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3,4,5-F ₃ | O | | 181-183 |
| 1-419 | CF ₃ | 1-MePr-c | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 100-101 |
| 1-420 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 3-F | O | | 66-67 |
| 1-421 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 4-M | O | | 87-89 |
| 1-422 | CF ₃ | CH ₂ SMe | Me | CH ₂ | 2-F-4-Cl | O | | 102-103 |

表 13

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Xn | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|----------------------|----------------------|----------------|------------------|----------------------|---|----------|---|
| 1-423 | CF ₃ | Et | Pr-i | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5207 |
| 1-424 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | H | O | | 104-105 |
| 1-425 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Et | H | O | | 63-65 |
| 1-426 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | 4-F | O | | 84-85 |
| 1-427 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | 4-Cl | O | | 106-108 |
| 1-428 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | 4-Me | O | | 94-96 |
| 1-429 | Pr-i | Pr-i | Me | N-Me | 4-F | O | | 1.5216 |
| 1-430 | Pr-i | Pr-i | Me | N-Me | 4-Cl | O | | 120-123 |
| 1-431 | Pr-i | Pr-i | Me | N-Me | 4-Me | O | | 93-94 |
| 1-432 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 97-98 |
| 1-433 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 93-95 |
| 1-434 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 110-111 |
| 1-435 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 79-81 |
| 1-436 | Pr-i | Et | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5455 |
| 1-437 | Pr-i | Et | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 66-67 |
| 1-438 | Pr-i | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 110-111 |
| 1-439 | Pr-i | Et | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 98-99 |
| 1-440 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-441 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 109-110 |
| 1-442 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 135-138 |
| 1-443 | CF ₃ | 3-thienyl | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 125-128 |
| 1-444 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2,3,5-F ₃ | O | | 167-169 |
| 1-445 | Pr-n | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 67-69 |
| 1-446 | Pr-n | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 117-118 |
| 1-447 | Pr-n | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 122-123 |
| 1-448 | Pr-n | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 89-90 |
| 1-449 | Pr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5402 |
| 1-450 | Pr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 83-84 |
| 1-451 | Pr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 78-79 |
| 1-452 | Pr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 94-95 |
| 1-453 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5253 |
| 1-454 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5221 |
| 1-455 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5101 |
| 1-456 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-457 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-458 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5191 |

表 14









| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(°C) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|---|---|------------------------------------|-------------------|----------------|---|----------|---|
| 1-459 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | 4-CN | O | | 144-145 |
| 1-460 | CF ₃ | Pr-i | Me | N-Me | 4-OMe | O | | 1.5081 |
| 1-461 | CF ₃ | Pr-i | Me | NHCH ₂ | H | O | | 92-95 |
| 1-462 | Pr-i | CH=NOMe | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-463 | Pr-i | CH=NOMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5309 |
| 1-464 | Pr-i | CH=NOMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5459 |
| 1-465 | Pr-i | CH=NOMe | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5412 |
| 1-466 | Pr-i | CH=NOMe | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5352 |
| 1-467 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5236 |
| 1-468 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5135 |
| 1-469 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5282 |
| 1-470 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 116-117 |
| 1-471 | CH=NOMe | Pr-i | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5481 |
| 1-472 |  |  | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-473 |  |  | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 110-112 |
| 1-474 |  |  | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-475 |  |  | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-476 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CO ₂ Et | CH ₂ | H | O | | 158-159 |
| 1-477 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CO ₂ Et | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-478 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CO ₂ Et | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-479 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CO ₂ Et | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-480 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | H | O | | |
| 1-481 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-482 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-Cl | O | | 164-166 |
| 1-483 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-Me | O | | 159-161 |
| 1-484 | CF ₃ | Ph(4-OMe) | Me | CH ₂ | H | O | | 97-98 |
| 1-485 | CF ₃ | Ph(4-OMe) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 103-105 |
| 1-486 | CF ₃ | Ph(4-OMe) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 131-133 |
| 1-487 | CF ₃ | Ph(4-OMe) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 147-150 |
| 1-488 | CF ₃ | Ph(2-OMe) | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |

表 15

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------------|-----------------------|------------------------------------|-----------------|----------------|---|----------|---|
| 1-489 | CF ₃ | Ph(2-OMe) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5474 |
| 1-490 | CF ₃ | Ph(2-OMe) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 測定不可 |
| 1-491 | CF ₃ | Ph(2-OMe) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5432 |
| 1-492 | Pr-n | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | 65-66 |
| 1-493 | Pr-n | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 83-84 |
| 1-494 | Pr-n | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 91-92 |
| 1-495 | Pr-n | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 55-56 |
| 1-496 | CH=NOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 113-116 |
| 1-497 | CH=NOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 155-156 |
| 1-498 | CH=NOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 122-123 |
| 1-499 | CH=NOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5468 |
| 1-500 | CH=NOH | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 171-172 |
| 1-501 | CH=NOH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 197-198 |
| 1-502 | CH=NOH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 183-184 |
| 1-503 | CH=NOH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 155-157 |
| 1-504 | CN | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 80-81 |
| 1-505 | CN | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 105-106 |
| 1-506 | CN | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 99-100 |
| 1-507 | CN | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 75-76 |
| 1-508 | CN | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5569 |
| 1-509 | Pr-i | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | H | O | | 1.5352 |
| 1-510 | Pr-i | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 112-113 |
| 1-511 | Pr-i | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 106-107 |
| 1-512 | Pr-i | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 104-105 |
| 1-513 | Pr-i | COMe | Me | CH ₂ | H | O | | 99-100 |
| 1-514 | Pr-i | COMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 114-115 |
| 1-515 | Pr-i | COMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 108-109 |
| 1-516 | Pr-i | COMe | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 119-120 |
| 1-517 | CMe(OMe) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 78-79 |
| 1-518 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₂ | H | O | | 121-122 |
| 1-519 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₂ | 4-F | O | | 129-130 |
| 1-520 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₂ | 4-Cl | O | | 124-127 |
| 1-521 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₂ | 4-Me | O | | 98-99 |
| 1-522 | CHO | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-523 | CHO | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5466 |
| 1-524 | CHO | Pr-i | M | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5609 |

表 16





| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------|----------------|---|-------------------------|--------------------|---|----------|---|
| 1-525 | CHO | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5558 |
| 1-526 | COMe | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |
| 1-527 | COMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5341 |
| 1-528 | COMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5501 |
| 1-529 | COMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5423 |
| 1-530 | COMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5395 |
| 1-531 | Pr-i | CH=NOH | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5365 |
| 1-532 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Cl | O | | 95-98 |
| 1-533 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(CH ₂ C≡CH) | 4-F | O | | 1.5121 |
| 1-534 | CF ₃ | Pr-i | Me | NHCH(Me) (R体) | H | O | | 69-70 |
| 1-535 | CF ₃ | Pr-i | Me | NHCH(Me) (S体) | H | O | | 1.5134 |
| 1-536 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 2-F | O | | 1.5043 |
| 1-537 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 2,4-F ₂ | O | | 1.4936 |
| 1-538 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | H | O | | 1.5451 |
| 1-539 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 4-F | O | | 1.5349 |
| 1-540 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 4-Cl | O | | 115-117 |
| 1-541 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 4-Me | O | | 1.5342 |
| 1-542 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂  | CH ₂ | H | O | | 1.5131 |
| 1-543 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂  | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5052 |
| 1-544 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂  | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5215 |
| 1-545 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂  | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5121 |
| 1-546 | CF ₃ | Ph(2-F) | Me | CH ₂ | H | O | | 109-110 |
| 1-547 | CF ₃ | Ph(2-F) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 107-108 |
| 1-548 | CF ₃ | Ph(2-F) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 139-141 |
| 1-549 | CF ₃ | Ph(2-F) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 107-110 |
| 1-550 | CF ₃ | Ph(2-Me) | Me | CH ₂ | H | O | | 146-147 |
| 1-551 | CF ₃ | Ph(2-M) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 149-150 |
| 1-552 | CF ₃ | Ph(2-Me) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-553 | CF ₃ | Ph(2-M) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 135-136 |

表 17

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|---------------------|-------------------------|-----------------------|------------------|----------------|---|----------|--|
| 1-554 | CF ₃ | Ph(2,4-F ₂) | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-555 | CF ₃ | Ph(2,4-F ₂) | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 102-104 |
| 1-556 | CF ₃ | Ph(2,4-F ₂) | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-557 | CF ₃ | Ph(2,4-F ₂) | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-558 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 131-132 |
| 1-559 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 93-96 |
| 1-560 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | 124-125 |
| 1-561 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | 110-111 |
| 1-562 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | 測定不可 |
| 1-563 | Pr-i | C(Me)=NOMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 73-74 |
| 1-564 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-565 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 82-83 |
| 1-566 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 98-99 |
| 1-567 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 78-80 |
| 1-568 | Pr-i | CN | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5399 |
| 1-569 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-F | O | | 131-133 |
| 1-570 | Bu-t | Et | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-571 | Bu-t | Et | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 88-90 |
| 1-572 | Bu-t | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 96-97 |
| 1-573 | Bu-t | Et | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 101-102 |
| 1-574 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ -Pr-c | CH ₂ | H | O | | |
| 1-575 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ -Pr-c | CH ₂ | 4-F | O | | 108-109 |
| 1-576 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ -Pr-c | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-577 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ -Pr-c | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-578 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | H | O | | |
| 1-579 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-F | O | | 162-163 |
| 1-580 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-581 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ CN | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-582 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-583 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-584 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5391 |
| 1-585 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-586 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5358 |
| 1-587 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-588 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-589 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5485 |

表 18

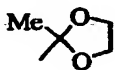
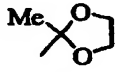
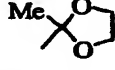
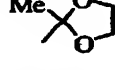
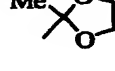
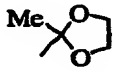
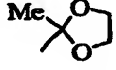
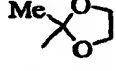
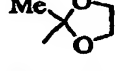
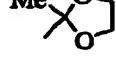
| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃)または屈折率(n _D ²⁰) |
|-------|---|---|----------------------|-----------------|----------------|---|----------|--|
| 1-590 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-591 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5382 |
| 1-592 | CO ₂ Me | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | A体 | 測定不可 |
| 1-593 | CO ₂ Me | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | B体 | 測定不可 |
| 1-594 | CO ₂ Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | A体 | 1.5406 |
| 1-595 | CO ₂ Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | B体 | 測定不可 |
| 1-596 |  | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-597 |  | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 171-173 |
| 1-598 |  | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 167-168 |
| 1-599 |  | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 141-142 |
| 1-600 |  | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 95-98 |
| 1-601 | Pr-i |  | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-602 | Pr-i |  | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 123-124 |
| 1-603 | Pr-i |  | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 133-134 |
| 1-604 | Pr-i |  | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 103-104 |
| 1-605 | Pr-i |  | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-606 | Et | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 58-59 |
| 1-607 | Et | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 76-77 |
| 1-608 | Et | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | 111-113 |
| 1-609 | Et | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | 90-91 |
| 1-610 | Pr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | |
| 1-611 | Pr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 70-71 |
| 1-612 | Pr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |

表 19

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|----------------------|----------------|----------------------|------------------|--------------------|---|----------|--|
| 1-613 | Pr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-614 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | 133-134 |
| 1-615 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2-F-4-Cl | O | | 122-124 |
| 1-616 | Pr-n | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 118-119 |
| 1-617 | Pr-n | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 106-107 |
| 1-618 | Pr-n | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | 111-112 |
| 1-619 | Pr-n | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | 98-99 |
| 1-620 | CF ₃ | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 93-96 |
| 1-621 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 137-138 |
| 1-622 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 159-161 |
| 1-623 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | 131-134 |
| 1-624 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | 153-154 |
| 1-625 | CH(OMe) ₂ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5371 |
| 1-626 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | 84-88 |
| 1-627 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | 127-130 |
| 1-628 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-629 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-630 | COPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 116-117 |
| 1-631 | C(Me)=NOMe | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5423 |
| 1-632 | CN | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | A体 | 130-132 |
| 1-633 | COMe | Bu-t | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 1.5439 |
| 1-634 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) (S体) | H | O | A体 | 128-131 |
| 1-635 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) (S体) | H | O | B体 | 1.5091 |
| 1-636 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | 4-Me | O | | 112-115 |
| 1-637 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | 4-OMe | O | | 123-126 |
| 1-638 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | 4-Br | O | | 108-111 |
| 1-639 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | OCH ₂ | H | O | | 1.5251 |
| 1-640 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | 4-NO ₂ | O | | 1.5301 |
| 1-641 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | H | S | | 132-135 |
| 1-642 | Et | Pr-i | Me | O | 4-Cl | O | | 80-83 |
| 1-643 | Pr-n | Pr-n | Me | O | 4-Cl | O | | 1.5379 |
| 1-644 | Pr-n | Pr-i | M | O | 4-Cl | O | | 1.5367 |
| 1-645 | M | Me | Me | O | 4-Cl | O | | 90-93 |
| 1-646 | Et | Et | M | O | 4-Cl | O | | 1.5468 |

表 20

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|--------------------------------------|---------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|---|----------|--|
| 1-647 | Pr-i | Pr-i | Me | O | H | O | | 1.5331 |
| 1-648 | Pr-i | Pr-i | Me | O | 4-Me | O | | 1.5346 |
| 1-649 | Pr-i | Pr-i | Me | O | 4-OMe | O | | 1.5282 |
| 1-650 | Pr-i | Pr-i | Me | O | 4-F | O | | 1.5169 |
| 1-651 | Et | CH(Me)SMe | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |
| 1-652 | Et | CH(Me)SMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 測定不可 |
| 1-653 | Et | CH(Me)SMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 88-91 |
| 1-654 | Et | CH(Me)SMe | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 1.5676 |
| 1-655 | NHCO ₂ CH ₂ Ph | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 161-163 |
| 1-656 | Et | C(Me) ₂ CO ₂ Me | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5502 |
| 1-657 | SOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-658 | SO ₂ Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-659 | OEt | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-660 | OEt | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-661 | OEt | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-662 | OEt | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-663 | OCHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-664 | OCHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-665 | OCHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-666 | OCHF ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-667 | SOCH ₂ CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-668 | SOCH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-669 | OCH ₂ CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-670 | OCH ₂ CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-671 | OCH ₂ CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-672 | OCH ₂ CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-673 | OCH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-674 | OCH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-675 | OCH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-676 | OCH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-677 | OPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-678 | OPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-679 | OPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-680 | OPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-681 | SPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |

表 21

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|---|--------------------------|----------------|-----------------|---------------------------------------|---|----------|--|
| 1-682 | SOPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-683 | SO ₂ Pr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-684 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-685 | NHMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-686 | NH(CHF ₂) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-687 | NH(CH ₂ OMe) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-688 | NH(CH ₂ SMe) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-689 | NHPr-c | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-690 | NHCOMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-691 | NHSO ₂ Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-692 | NHCO ₂ Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-693 | NH(CH ₂ CH=CH ₂) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-694 | NH(CH ₂ C≡CH) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-695 | CH(Me)CH=CH ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-696 | CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-697 | OH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-698 | CO ₂ H | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-699 | CON(-C ₄ H ₉ -) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-700 | CONH(CH ₂ CH=CH ₂) | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-701 | Pr-i | CH(Me)CH=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-702 | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-703 | Et | CHClMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-704 | Et | OEt | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-705 | Et | CH(Me)CN | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-706 | Et | CO ₂ Me | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-707 | Et | CHMeN(Me) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-708 | Et | CON(Me) ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-709 | Et | CHMeCONMe ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | 0 | | |
| 1-710 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OCH ₂ CH=CH ₂ | 0 | | |
| 1-711 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-OPr-c | 0 | | |
| 1-712 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-COMe | 0 | | |

表 22

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-------------------------|----------------|----------------------|-----------------|--------------------------------------|---|----------|--|
| 1-713 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CO ₂ Me | O | | |
| 1-714 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-SOMe | O | | |
| 1-715 | Et | Pr-i | N(NMe ₂) | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-716 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CH ₂ CH=CH ₂ | O | | |
| 1-717 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CH ₂ C≡CH | O | | |
| 1-718 | CO ₂ H | Pr-i | N(Me) | CH(Me) | 4-Cl | O | | 168-170 |
| 1-719 | CH=CHCO ₂ Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 57-59 |
| 1-720 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | 111-113 |
| 1-721 | COEt | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-722 | COEt | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-723 | COEt | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-724 | COEt | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-725 | COEt | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-726 | COEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-727 | COEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-728 | COEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-729 | COEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | |
| 1-730 | COEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-731 | COEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-732 | COEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-733 | COEt | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | |
| 1-734 | COEt | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-735 | COEt | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-736 | COEt | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-737 | COMe | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-738 | COMe | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-739 | COMe | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-740 | COMe | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-741 | COMe | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | |
| 1-742 | COMe | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-743 | COMe | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-744 | COMe | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-745 | COMe | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | |
| 1-746 | COMe | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-747 | COMe | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-748 | COMe | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |

表 23

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|----------------|----------------|----------------------|-----------------|----------------|---|----------|--|
| 1-749 | COPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-750 | COPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-751 | COPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-752 | COPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-753 | COPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-754 | COPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-755 | COPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-756 | COPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | |
| 1-757 | COPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-758 | COPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-759 | COPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-760 | COPr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | |
| 1-761 | COPr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-762 | COPr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-763 | COPr-i | Pr-n | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-764 | OEt | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-765 | OEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-766 | OEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-767 | OEt | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-768 | OEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | |
| 1-769 | OEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-770 | OEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-771 | OEt | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-772 | OPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-773 | OPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-774 | OPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-775 | OPr-i | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-776 | OPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-777 | OPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-778 | OPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-779 | OPr-i | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-780 | OPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | H | O | | |
| 1-781 | OPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-782 | OPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-783 | OPr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH(Me) | 4-M | O | | |
| 1-784 | Et | Ph | M | CH ₂ | H | O | | |
| 1-785 | Et | Ph | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |

表 24

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|-----------------------|------------------------|----------------|----------------------|----------------|---|----------|--|
| 1-786 | Et | Ph | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 63-66 |
| 1-787 | Et | Ph | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-788 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-789 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-790 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-791 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-792 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-793 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-794 | N(Me) ₂ | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-795 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | H | O | | |
| 1-796 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-797 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-798 | Et | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | H | O | | |
| 1-799 | Et | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-800 | Et | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-801 | Et | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-802 | Pr-i | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | H | O | | |
| 1-803 | Pr-i | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-804 | Pr-i | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-805 | Pr-i | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-806 | C(Me)=CH ₂ | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-807 | C(Me)=CH ₂ | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-808 | C(Me)=CH ₂ | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-809 | C(Me)=CH ₂ | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-810 | Pr-n | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-811 | Pr-n | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-812 | Pr-n | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-813 | Pr-n | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-814 | Et | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-815 | Et | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-816 | Et | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-817 | Et | C(Me)=CH ₂ | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-818 | Et | OE _t | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-819 | Et | CH(Me)CN | M | CH(M) | 4-Cl | O | | |
| 1-820 | Et | CO ₂ Me | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-821 | Et | CHMeN(Me) ₂ | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |

表 25

| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジア ステ レオ マー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-----------|---------------------------------|------------------------|----------------------|-----------------|----------------|---|----------------------|--|
| 1-822 | Et | CON(Me) ₂ | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-823 | Et | CHMeCONMe ₂ | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-824 | Bu-t | Et | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | H | O | | |
| 1-825 | Bu-t | Et | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-826 | Bu-t | Et | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-827 | Bu-t | Et | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-828 | COPr-c | Pr-n | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-829 | COPr-c | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-830 | COPr-c | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-831 | COPr-c | Pr-n | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-832 | Et | C(Me) ₂ OH | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-833 | Et | C(Me) ₂ OH | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-834 | Et | C(Me) ₂ OH | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-835 | Et | C(Me) ₂ OH | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-836 | Et | C(Me) ₂ Cl | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-837 | Et | C(Me) ₂ Cl | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-838 | Et | C(Me) ₂ Cl | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-839 | Et | C(Me) ₂ Cl | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-840 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-841 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-842 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-843 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-844 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH(Me) | H | O | | |
| 1-845 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-F | O | | |
| 1-846 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | |
| 1-847 | N(Me)CH ₂ C≡CH | Pr-i | Me | CH(Me) | 4-Me | O | | |
| 1-848 | CH ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-849 | CH ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-850 | CH ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-851 | CH ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-852 | CF ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | 106-108 |
| 1-853 | CF ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 118-119 |
| 1-854 | CF ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 122-123 |
| 1-855 | CF ₂ CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | 68-69 |
| 1-856 | OCF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-857 | OCF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |

表 26



| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | X _n | Q | ジアステレオマー | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-------|---|---|----------------------|----------------------|--------------------|---|----------|--|
| 1-858 | OCF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-859 | OCF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-860 | Et | CH(Me)OMe | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-861 | Et | CH(Me)OMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-862 | Et | CH(Me)OMe | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | |
| 1-863 | Et | CH(Me)OMe | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-864 | Et | CH(Me)CN | Me | CH ₂ | H | O | | |
| 1-865 | Et | CH(Me)CN | Me | CH ₂ | 4-F | O | | |
| 1-866 | Et | CH(Me)CN | Me | CH ₂ | 4-Me | O | | |
| 1-867 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3,4-F ₂ | O | | |
| 1-868 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | |
| 1-869 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-F | O | | |
| 1-870 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2,4-F ₂ | O | | 110-113 |
| 1-871 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) (R-体) | H | O | A-体 | 144-146 |
| 1-872 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) (R-体) | H | O | B-体 | 1.5164 |
| 1-873 | CClF ₂ | Pr-i | Me | N(Me) | H | O | | 1.5341 |
| 1-874 | CF ₃ | Pr-i | Me | NHN(Me) | H | O | | 72-75 |
| 1-875 | CH ₂ CH(OMe) ₂ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 90-91 |
| 1-876 | CH ₂ CN | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 106-107 |
| 1-877 |  | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5552 |
| 1-878 | COMe | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 1.5612 |
| 1-879 | CMe=NOMe | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 81-83 |
| 1-880 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me)CH ₂ | H | O | | 63-66 |
| 1-881 | CH=NOMe | Pr-n | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 測定不可 |
| 1-882 | CN | Pr-n | Me | CH(Me) | 4-Cl | O | | 103-106 |
| 1-883 | Et |  | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 161-162 |
| 1-884 | Et | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |
| 1-885 | Et | CMe=NOMe | Me | CH ₂ | H | O | | 測定不可 |
| 1-886 | Et | CMe(OMe) ₂ | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 測定不可 |
| 1-887 | Et | COMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 71-73 |
| 1-888 | Et | CMe=NOMe | Me | CH ₂ | 4-F | O | | 1.5443 |
| 1-889 | COOH | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | O | | 139-141 |
| 1-890 | CN | Bu-t | Me | CHMe | 4-Cl | O | B-体 | 106-108 |

表 27

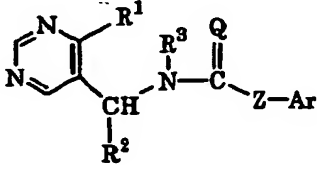
|  | | | | | | | |
|---|------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---|--|
| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Ar | Q | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 2-1 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-naphtyl | O | 137-138 |
| 2-2 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | 37-38 |
| 2-3 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-pyridyl | O | 99-100 |
| 2-4 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-pyridyl | O | 93-96 |
| 2-5 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-pyridyl | O | 115-118 |
| 2-6 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | 51-54 |
| 2-7 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | 2-thienyl | O | 69-71 |
| 2-8 | CHF ₂ | Pr-i | Et | CH ₂ | 3-thienyl | O | 83-85 |
| 2-9 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 2-thienyl | O | 1.5197 |
| 2-10 | CF ₃ | Pr-i | Et | CH ₂ | 3-thienyl | O | 1.5208 |
| 2-11 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | 1.5215 |
| 2-12 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | 1.5229 |
| 2-13 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | 1.5121 |
| 2-14 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | 58-62 |
| 2-15 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-16 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 3-thienyl | O | |
| 2-17 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-18 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH(Me) | 3-thienyl | O | |
| 2-19 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | 139-142 |
| 2-20 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | 142-145 |
| 2-21 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-22 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-23 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | 79-81 |
| 2-24 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | 101-103 |
| 2-25 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 94-95 |
| 2-26 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-27 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-28 | SMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |

表 28



| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Ar | Q | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|---|----------------|-------------------|--|---|--|
| 2-29 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 79-81 111-113 |
| 2-30 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-31 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-32 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-33 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-34 | CF ₃ | Ph | Me | CH(Me) | 3-thienyl | O | |
| 2-35 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-CF ₃ -2-thienyl | O | |
| 2-36 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-F-2-thienyl | O | |
| 2-37 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-38 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-F-2-thienyl | O | |
| 2-39 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-3-thienyl | O | 160-161 106-107 145-147 120-122 138-141 108-112 121-122 192-195 164-167 73-75 68-70 81-82 94-98 86-87 92-93 111-112 1.5295 |
| 2-40 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-3-thienyl | O | |
| 2-41 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Br-pyrazol-1-yl | O | |
| 2-42 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-43 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 5-Cl-2-pyridyl | O | |
| 2-44 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 5-Cl-3-pyridyl | O | |
| 2-45 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 3-Cl-5-CF ₃ -pyridin-2-yl | O | |
| 2-46 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 1-Me-3-CF ₃ -5-Pyrazolyl | O | |
| 2-47 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 5-CF ₃ -1,3,4-thiaziazol-2-yl | O | |
| 2-48 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 2-benzothiazolyl | O | |
| 2-49 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ O | 4-CF ₃ -pyridin-2-yl | O | 73-75 68-70 81-82 94-98 86-87 92-93 111-112 1.5295 |
| 2-50 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-51 | CF ₃ | Bu-i | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-52 | CF ₃ | Bu-i | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-53 | CF ₃ | Bu-t | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-54 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | Pr-c | O | |
| 2-55 | CF ₃ |  | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-56 | CF ₃ |  | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-57 | CF ₃ | Bu-s | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thi nyl | O | |

表 29



| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Ar | Q | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|-----------|---------------------|---|----------------------|-----------------|---|---|--|
| 2-58 | CF ₃ |  | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 測定不可 |
| 2-59 | CF ₃ |  | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | 71-74 |
| 2-60 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 5-Me-2-thienyl | O | 1.5141 |
| 2-61 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 5-Br-2-thienyl | O | 1.5331 |
| 2-62 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH(Me) | 2-thienyl | O | 30℃以下 |
| 2-63 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 3-thienyl | O | 1.5244 |
| 2-64 | CF ₃ | Pr-i | Me | NH | 2-benzothiazolyl | O | 180-182 |
| 2-65 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 5-Cl-pyridin-2-yl | O | 39-40 |
| 2-66 | CF ₃ | Pr-i | Me | NH | cyclohexyl | O | 110-112 |
| 2-67 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 3-Me-5-isoxazolyl | O | 1.4939 |
| 2-68 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 4-MeO-6-Me-pyrimidin-2-yl | O | 107-110 |
| 2-69 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 4,6-(MeO) ₂ -1,3,5-triazinyl | O | 112-113 |
| 2-70 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 6-MeO-pyridin-3-yl | O | 1.5079 |
| 2-71 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 112-115 |
| 2-72 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | cyclohexyl | O | 98-100 |
| 2-73 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 90-91 |
| 2-74 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 117-118 |
| 2-75 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 測定不可 |
| 2-76 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 1.5488 |
| 2-77 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-thienyl | O | 1.5508 |
| 2-78 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-thienyl | O | 112-114 |
| 2-79 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-thienyl | O | 128-131 |
| 2-80 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | O | 1-naphtyl | O | 123-126 |
| 2-81 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-CF ₃ -1,3,4-thiadizol-2-yl | O | |
| 2-82 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-CF ₃ -1,3,4-imidazol-2-yl | O | |
| 2-83 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-Cl-5-oxazolyl | O | |
| 2-84 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-Cl-5-thiazolyl | O | |
| 2-85 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Cl-2-furyl | O | |

表 30

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | Z | Ar | Q | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|----------------|----------------------|-------------------|----------------|---|--|
| 2-86 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-benzoxazolyl | O | 110-112 |
| 2-87 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-88 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-89 | Et | Pr-i | Me | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-90 | Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-91 | Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 3-thienyl | O | |
| 2-92 | Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-93 | Et | Pr-i | Me | CH(Me) | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-94 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-95 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-96 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-97 | Et | Bu-s | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-98 | Et | Bu-s | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-99 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-100 | Et | Bu-t | Me | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-101 | Et | Bu-s | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-102 | Et | Bu-s | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-103 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 2-thienyl | O | |
| 2-104 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | CH ₂ | 3-thienyl | O | |
| 2-105 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-106 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-107 | CF ₃ | Pr-i | Me | N(Me) | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-108 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 2-thienyl | O | |
| 2-109 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 3-thienyl | O | |
| 2-110 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 5-Cl-2-thienyl | O | |
| 2-111 | Et | Pr-i | Me | N(Me) | 5-Me-2-thienyl | O | |
| 2-112 | CF ₃ | Pr-i | Me | NHCH ₂ | 2-thienyl | O | |

表 31

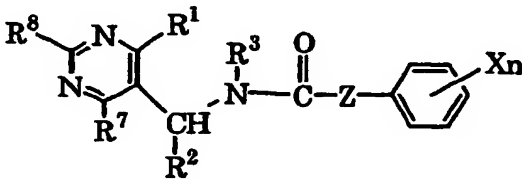
|  | | | | | | | | |
|--|-----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|--|
| 化合物 番号 | R ₁ | R ₂ | R ₃ | Z | X _n | R ₇ | R ₆ | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 3-1 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | H | Me | 99-101 |
| 3-2 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | H | Me | 74-75 |
| 3-3 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | H | Me | 67-68 |
| 3-4 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | H | Me | 85-86 |
| 3-5 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | H | Pr-c | 144-145 |
| 3-6 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | H | Pr-c | 131-132 |
| 3-7 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | H | Pr-c | 99-100 |
| 3-8 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | H | Pr-c | 82-83 |
| 3-9 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | Me | H | |
| 3-10 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | Me | H | |
| 3-11 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | Me | H | |
| 3-12 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | Me | H | |
| 3-13 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | H | Me | H | |
| 3-14 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | Me | H | |
| 3-15 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | Me | H | |
| 3-16 | Me | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | Me | H | |
| 3-17 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | H | Me | H | |
| 3-18 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | Me | H | |
| 3-19 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | Me | H | |
| 3-20 | Pr-i | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | Me | H | |
| 3-21 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | H | Me | H | |
| 3-22 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-F | Me | H | |
| 3-23 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Cl | Me | H | |
| 3-24 | Me | Bu-t | Me | CH ₂ | 4-Me | Me | H | |
| 3-25 | Et | Et | Me | CH ₂ | H | Et | H | |
| 3-26 | Et | Et | Me | CH ₂ | 4-F | Et | H | |

表 32

| 化合物 番 号 | R ₁ | R ₂ | R ₃ | Z | X _n | R ₇ | R ₈ | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|--|
| 3-27 | Et | Et | Me | CH ₂ | 4-Cl | Et | H | |
| 3-28 | Et | Et | Me | CH ₂ | 4-Me | Et | H | |
| 3-29 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | H | SMe | |
| 3-30 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | H | SMe | |
| 3-31 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | H | SMe | |
| 3-32 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | H | SMe | |
| 3-33 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | H | Me | H | |
| 3-34 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-F | Me | H | |
| 3-35 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-Cl | Me | H | |
| 3-36 | CF ₃ | Ph | Me | CH ₂ | 4-Me | Me | H | |
| 3-37 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | H | CF ₃ | H | |
| 3-38 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-F | CF ₃ | H | |
| 3-39 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | CF ₃ | H | |
| 3-40 | CF ₃ | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Me | CF ₃ | H | |
| 3-41 | OMe | Pr-i | Me | CH ₂ | 4-Cl | OMe | H | 107-109 |
| 3-42 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Cl | H | Me | 104-107 |
| 3-43 | CF ₃ | Pr-i | Me | O | 4-Cl | H | Pr-c | 1.5178 |

表 33

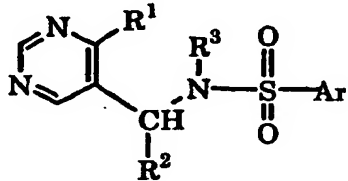
|  | | | | | |
|---|----------------------|----------------|----------------------|------------------------|--|
| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | Ar | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 4-1 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-Cl) | 1.5246 |
| 4-2 | Et | Pr-i | Me | Ph | 1.5446 |
| 4-3 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-F) | 1.5399 |
| 4-4 | Et | Pr-i | Me | Ph(3-F) | 1.541 |
| 4-5 | Et | Pr-i | Me | Ph(2-F) | 1.5441 |
| 4-6 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-Cl) | 1.5562 |
| 4-7 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-Me) | 1.5475 |
| 4-8 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-CN) | 1.5527 |
| 4-9 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-OMe) | 102-103 |
| 4-10 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-NO ₂) | 106-107 |
| 4-11 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-F) | 93-95 |
| 4-12 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | Ph(4-F) | 1.5365 |
| 4-13 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | Ph(4-F) | 1.5234 |
| 4-14 | Et | Pr | CH ₂ C≡CH | Ph(4-F) | 1.5445 |
| 4-15 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph | 1.518 |
| 4-16 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-CF ₃) | |
| 4-17 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-F) | |
| 4-18 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(3-F) | |
| 4-19 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(2-F) | |
| 4-20 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-Me) | |
| 4-21 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-CN) | |
| 4-22 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-OMe) | |
| 4-23 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(4-NO ₂) | |
| 4-24 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-F) | |
| 4-25 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(2-Me) | |
| 4-26 | Et | Pr-i | Me | Ph(2-Me) | 1.5512 |
| 4-27 | CF ₃ | Pr-i | Me | Ph(3-Me) | |
| 4-28 | Et | Pr-i | M | Ph(3-Me) | 1.5499 |

表 34

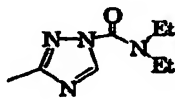
| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | R ³ | Ar | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|------------|--------------------|----------------|----------------------|--|--|
| 4-29 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-F) | |
| 4-30 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Cl) | |
| 4-31 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Cl) | |
| 4-32 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph | |
| 4-33 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph | |
| 4-34 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Me) | |
| 4-35 | CF ₃ | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Me) | |
| 4-36 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | Ph | 1.5382 |
| 4-37 | CF ₂ Cl | Pr-i | Me | Ph(4-F) | 1.4929 |
| 4-38 | Pr-i | Pr-i | Me |  | 132-133 |
| 4-39 | Pr-i | Pr-i | Me | | |
| 4-40 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(3-F) | |
| 4-41 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(2-F) | |
| 4-42 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-Me) | |
| 4-43 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-CN) | |
| 4-44 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-OMe) | |
| 4-45 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(4-NO ₂) | |
| 4-46 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-F) | |
| 4-47 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(2-Me) | |
| 4-48 | Pr-i | Pr-i | Me | Ph(3-Me) | |
| 4-49 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-F) | |
| 4-50 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Cl) | |
| 4-51 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph | |
| 4-52 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | Ph(4-Me) | |
| 4-53 | Et | Pr-i | Me | Ph(4-CF ₃) | 1.5117 |
| 4-54 | Et | Et | Me | Ph(4-F) | 1.5462 |
| 4-55 | Et | Pr-i | Me | 2-thienyl | 109-110 |

表 35

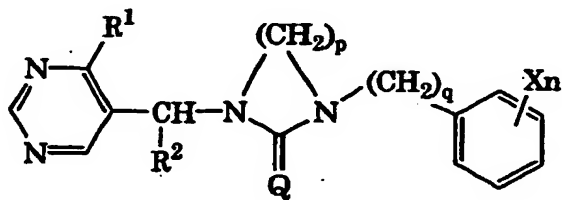
|  | | | | | | | |
|---|-----------------|----------------|---|---|---|------|--|
| 化合物 番号 | R ¹ | R ² | p | Q | q | Xn | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
| 5-1 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 0 | H | 126-128 |
| 5-2 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 0 | 4-F | 1.5279 |
| 5-3 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 0 | 4-Cl | |
| 5-4 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 0 | 4-Me | |
| 5-5 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 0 | H | |
| 5-6 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-F | |
| 5-7 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-Cl | |
| 5-8 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-Me | |
| 5-9 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 1 | H | 93-95 |
| 5-10 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-F | 1.5090 |
| 5-11 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-Cl | |
| 5-12 | CF ₃ | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-Me | |
| 5-13 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 1 | H | 1.5181 |
| 5-14 | CF ₃ | Pr-I | 3 | O | 1 | 4-F | |
| 5-15 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 1 | 4-Cl | |
| 5-16 | CF ₃ | Pr-i | 3 | O | 1 | 4-Me | |
| 5-17 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 0 | H | |
| 5-18 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-F | |
| 5-19 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-Cl | |
| 5-20 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-Me | |
| 5-21 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 1 | H | |
| 5-22 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-F | |
| 5-23 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-Cl | |
| 5-24 | CF ₃ | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-Me | |
| 5-25 | CF ₃ | Pr-i | 2 | S | 1 | H | 138-140 |

表 36

| 化合物 番 号 | R ¹ | R ² | p | Q | q | Xn | 融点(℃) または 屈折率 (n _D ²⁰) |
|------------|-----------------|----------------|---|---|---|------|--|
| 5-26 | CF ₃ | Pr-i | 2 | S | 1 | 4-F | |
| 5-27 | CF ₃ | Pr-i | 2 | S | 1 | 4-Cl | |
| 5-28 | CF ₃ | Pr-i | 2 | S | 1 | 4-Me | |
| 5-29 | Et | Pr-i | 3 | O | 0 | H | |
| 5-30 | Et | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-F | |
| 5-31 | Et | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-Cl | |
| 5-32 | Et | Pr-i | 3 | O | 0 | 4-Me | |
| 5-33 | Et | Pr-i | 2 | O | 1 | H | |
| 5-34 | Et | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-F | |
| 5-35 | Et | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-Cl | |
| 5-36 | Et | Pr-i | 2 | O | 1 | 4-Me | |
| 5-37 | Et | Pr-i | 3 | O | 1 | H | |
| 5-38 | Et | Pr-I | 3 | O | 1 | 4-F | |
| 5-39 | Et | Pr-i | 3 | O | 1 | 4-Cl | |
| 5-40 | Et | Pr-i | 3 | O | 1 | 4-Me | |
| 5-41 | Et | Pr-i | 3 | S | 0 | H | |
| 5-42 | Et | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-F | |
| 5-43 | Et | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-Cl | |
| 5-44 | Et | Pr-i | 3 | S | 0 | 4-Me | |
| 5-45 | Et | Pr-i | 3 | S | 1 | H | |
| 5-46 | Et | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-F | |
| 5-47 | Et | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-Cl | |
| 5-48 | Et | Pr-i | 3 | S | 1 | 4-Me | |

表 37

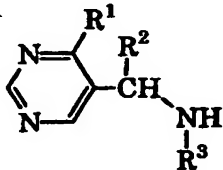


|  | | | | |
|---|----------------------|----------------------|----------------|---|
| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | 融点(℃)、屈折率(n _D ²⁰) 又は NMR (δ (ppm), 300MHz, CDCl ₃) |
| 6-1 | Pr-i | Pr-i | Me | 44-45 |
| 6-2 | Pr-i | Et | Me | 1.4902 |
| 6-3 | Et | Pr-i | Me | 0.86(3H,d); 0.99(3H,d); 1.32(3H,t); 1.65(1H,br); 1.85-1.95(1H,m); 2.23(3H,s); 2.77-2.95(2H,m); 3.58(1H,d); 8.68(1H,s); 9.02(1H,s) |
| 6-4 | Pr | Pr-i | Me | 0.86(3H,d); 0.99(3H,d); 1.00(3H,t); 1.44(1H,br); 1.73-1.83(2H,m); 1.83- 1.95(1H,m); 2.23(3H,s); 2.68- 2.90(2H,m); 3.59(1H,d); 8.69(1H,s); 9.01(1H,s) |
| 6-5 | Pr-i | Pr | Me | 1.4929 |
| 6-6 | Et | Bu-t | Me | 74-75 |
| 6-7 | Bu-t | Et | Me | 1.02(3H,t); 1.46(9H,s); 1.65- 1.72(1H,m); 2.33(3H,s); 4.16(1H,t); 8.85(1H,s); 9.00(1H,s) |
| 6-8 | Pr-i | CH(OEt) ₂ | Me | 1.4794 |
| 6-9 | CH(OEt) ₂ | Pr-i | Me | 0.85(3H,d); 0.99(3H,d); 1.24(3H,t); 1.45(1H,br); 1.95-2.04(1H,m); 2.23(1H,s); 3.53-3.66(2H,m); 3.72- 4.04(2H,m); 4.03(1H,d); 5.57(1H,s); 8.87(1H,s); 9.09(1H,s) |

表 38

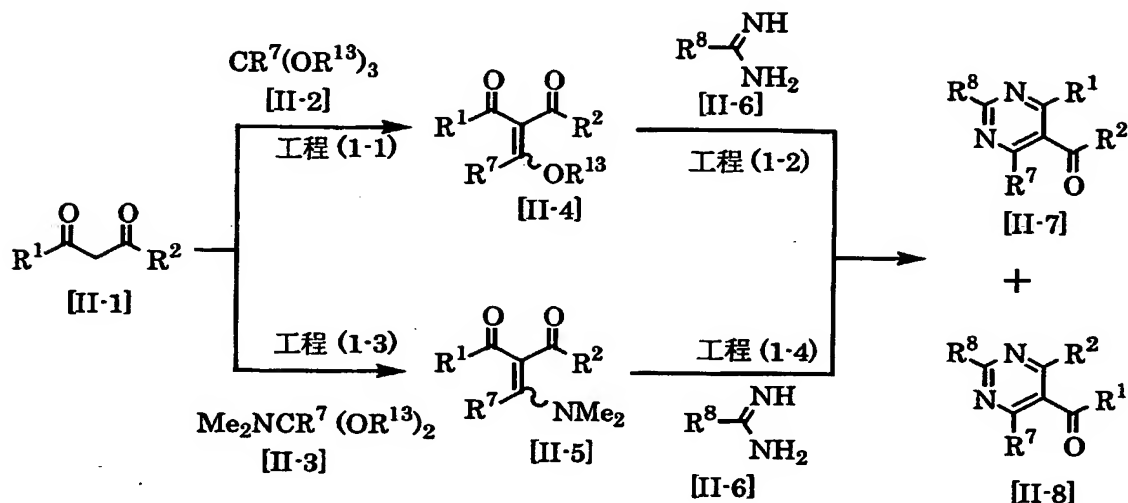
| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | 融点(°C)、屈折率(n _D ²⁰) 又は NMR (δ (ppm), 300MHz, CDCl ₃) |
|-------|----------------------|---------------------|----------------------|--|
| 6-10 | CH(OEt) ₂ | Pr-n | Me | 1.4811 |
| 6-11 | CH(OEt) ₂ | Bu-t | Me | 1.4781 |
| 6-12 | Pr | Pr | Me | 1.4978 |
| 6-13 | Et | Pr | Me | |
| 6-14 | Pr | Et | Me | |
| 6-15 | Pr-i | CH ₂ OMe | Me | 1.29(3H,d), 1.29(3H,d), 2.29(3H,s), 3.39(3H,s), 3.30-3.46(2H,m), 3.30- 3.46(1H,m), 4.1(1H,dd), 8.80(1H,s), 9.07(1H,s) |
| 6-16 | CH ₂ OMe | Pr-i | Me | 0.83(3H,d); 1.01(3H,d); 1.89- 2.63(1H,m); 2.22(3H,s); 3.46(3H,s); 3.61(1H,d); 4.64(2H,q); 8.80(1H,s); 9.10(1H,s) |
| 6-17 | SMe | Pr-i | Me | 1.5509 |
| 6-18 | Pr-i | Pr-i | CH ₂ C≡CH | 0.86(3H,d); 1.01(3H,d); 1.88- 1.95(1H,m); 2.22(1H,t); 2.95(1H,dd); 3.38-3.48(1H,m); 3.38-3.44(1H,dd); 4.04(1H,d); 8.71(1H,s); 9.06(1H,s) |
| 6-19 | Pr-i | Et | CH ₂ C≡CH | |
| 6-20 | Et | Pr-i | CH ₂ C≡CH | 1.5185 |
| 6-21 | Pr | Pr-i | CH ₂ C≡CH | 46-48 |
| 6-22 | Pr-i | Pr | CH ₂ C≡CH | 0.86(3H,d); 0.93(3H,d); 1.29(3H,d); 1.29(3H,d); 1.27-1.42(2H,m); 1.55- 1.70(2H,m); 2.23(1H,t); 3.03(1H,dd); 3.40(1H,dd); 3.37-3.50(1H,m); 4.29(1H,t); 8.74(1H,s); 9.05(1H,s) |
| 6-23 | Et | Bu-t | CH ₂ C≡CH | 0.95(9H,s); 1.33(3H,t); 2.22(1H,t); 2.88(1H,dd); 2.93(2H,q); 3.41(1H,dd); 4.11(1H,s); 8.79(1H,s); 9.02(1H,s) |

表 39

| 化合物番号 | R ¹ | R ² | R ³ | 融点(°C)、屈折率(n _D ²⁰) 又は NMR (δ (ppm), 300MHz, CDCl ₃) |
|-------|---|---|----------------------|--|
| 6-24 | Bu-t | Et | CH ₂ C≡CH | 0.87(3H,t); 0.94(3H,t); 1.18-1.45(2H,m); 1.33(3H,t); 1.55-1.74(2H,m); 2.45(1H,t); 2.87(2H,q); 3.04(1H,dd); 3.43(1H,dd); 4.25(1H,t); 8.75(1H,s); 9.01(1H,s) |
| 6-25 | Pr | Pr | CH ₂ C≡CH | |
| 6-26 | Et | Pr | CH ₂ C≡CH | |
| 6-27 | Pr | Et | CH ₂ C≡CH | 0.89(3H,t); 0.94(3H,t); 1.47(1H,br); 1.66(3H,d); 1.68(3H,d); 1.60-1.81(2H,m); 2.05(3H,s); 2.07(3H,s); 2.29(3H,s); 2.33(3H,s); 3.77(1H,t); 3.86(1H,t); 4.33(1H,q); 4.42(1H,q); 8.71(1H,s); 8.77(1H,s); 9.08(1H,s) |
| 6-28 | Et | CH(Me)(SMe) | N(Me) | |
| 6-29 | Ph | Pr-i | N(Me) | 1.5632 |
| 6-30 | Pr-i | Me | N(Me) | 1.5012 |
| 6-31 | Bu-t | Me | N(Me) | 72-73 |
| 6-32 | Pr-i | Ph | N(Me) | 1.5598 |
| 6-33 | CMe(OMe) ₂ | Pr-i | N(Me) | 75-76 |
| 6-34 | Pr-i |  | N(Me) | 79-78 |
| 6-35 | Pr-i | CH=NOMe | N(Me) | 1.5079 |
| 6-36 |  | Pr-i | N(Me) | 1.5089 |
| 6-37 | Et | Et | N(Me) | 1.5049 |

本発明化合物は、例えば以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。尚、製造中間体の合成法も併せて記載する。

<製造法 1>



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^7 及び R^8 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R^{13} は C1～C6 アルキル基を表す。)

即ち、工程(1-1)では一般式 [II-1] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [II-2] で表される化合物 1～10 当量を無水酢酸中で反応させることにより、一般式 [II-4] で表される化合物を得ることができる。ここで、場合により触媒 (例えば塩化亜鉛等を例示できる。) 0.01～1.0 当量を添加しても良い。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間～100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(1-2)では一般式 [II-4] で表される化合物 1 当量に対し、塩基 1～10 当量の存在下、一般式 [II-6] で表される化合物のルイス酸塩 1～10 当量を不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [II-7] で表される化合物を得ることができる。本反応は、場合により一般式 [II-8] で表される化合物も副生

成物として得られる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

塩基としては、例えばナトリウム、カリウム等のアルカリ金属、ナトリウムメトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド、水素化ナトリウム又は水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物を例示できる。

ルイス酸としては酢酸、塩酸等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

又、工程(1-3)では一般式 [II-1] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [II-3] で表される化合物 1~10 当量を、無溶媒又は不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [II-5] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えば *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

更に、工程(1-4)では一般式 [II-5] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [II-6] で表される化合物のルイス酸塩 1~5 当量を、不活性溶媒中、塩基 1~10 当量の存在下、反応させることにより、一般式 [II-7] で表される化合物を得ることができる。本反応は、場合により一般式 [II-8] で表される化合物も副生成物として得られる。

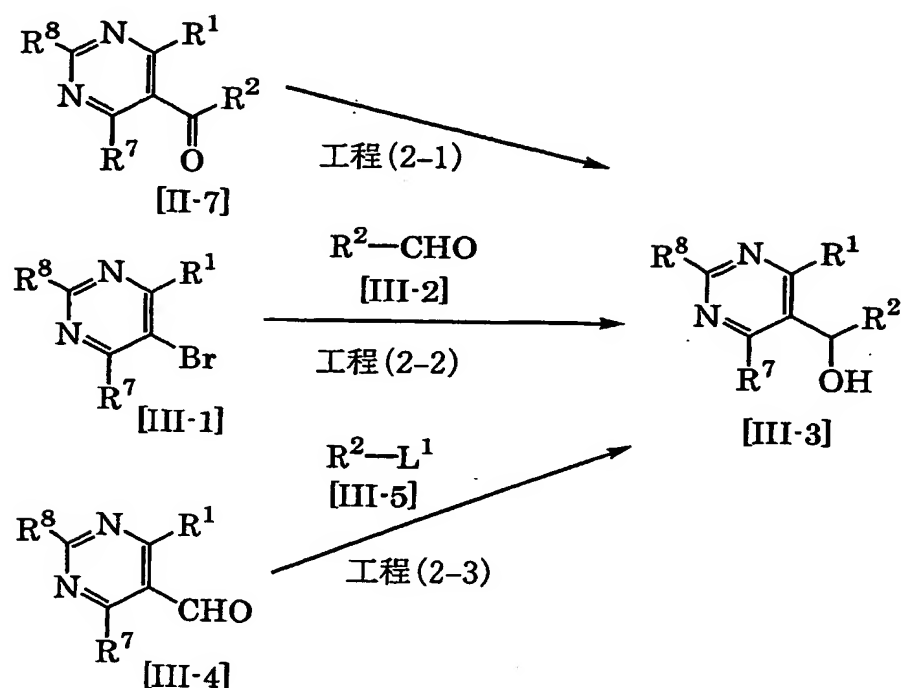
不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

塩基としては、例えばナトリウム、カリウム等のアルカリ金属、ナトリウムメトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド、水素化ナトリウム、又は水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物を例示できる。

ルイス酸としては酢酸、塩酸等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 2>



(L^1 はハロゲン原子を表し、式中、 R^1 、 R^2 、 R^7 及び R^8 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(2-1)では一般式 [II-7] で表される化合物 1 当量を、不活性溶媒中、還元剤 (例えばボラン-*tert*-ブチルアミン錯体又は水素化ホウ素ナトリウム等を例示できる。) 0.5~10 当量で還元することにより、一般式 [III-3] で表され

る化合物を得ることができる。

不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール、tert-ブチルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(2-2)では一般式 [III-1] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [III-2] で表される化合物 1～10 当量を、メチルリチウム、エチルリチウム又は n-ブチルリチウム等のアルキルリチウム類、或いはマグネシウム 1～10 当量の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [III-3] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -100°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

なお、上記製造方法で用いる製造中間体である一般式 [III-1] で表される化合物は、例えば、国際出願 WO97/37978 号公報明細書等に記載の方法で合成できる。

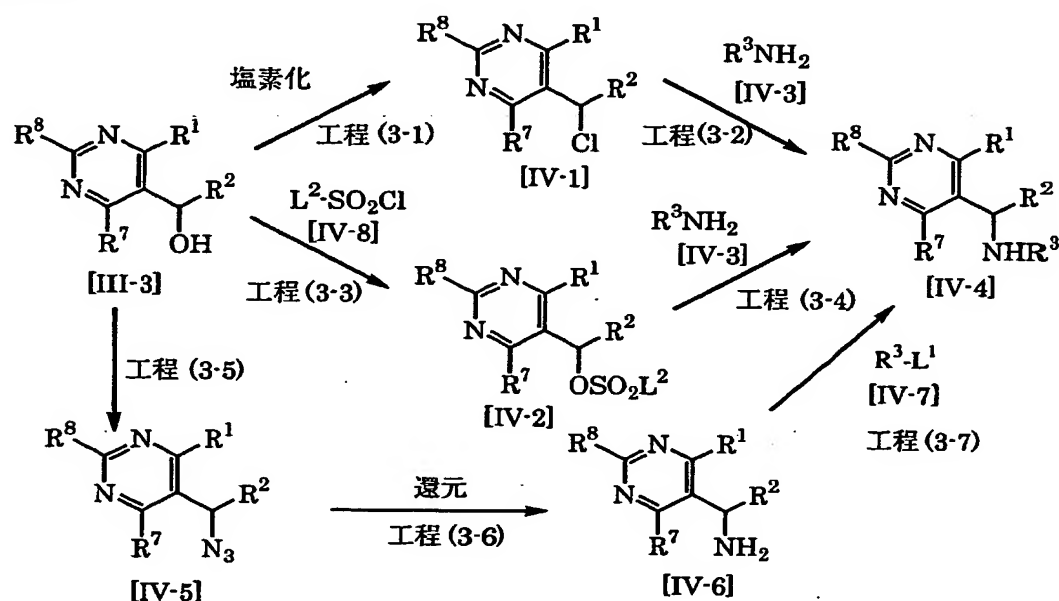
工程(2-3)では一般式 [III-4] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [III-5] で表される化合物 1～10 当量を、メチルリチウム、エチルリチウム又は n-ブチルリチウム等のアルキルリチウム類、或いはマグネシウム 1～10 当量の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [III-3] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシ

レン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -100°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 3>



(式中、 L^2 は $C1\sim C6$ アルキル基又は $C1\sim C6$ アルキル基が置換されてもよいフェニル基を表し、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 及び L^1 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(3-1)では一般式 [III-3] で表される化合物 1 当量を、不活性溶媒中、塩素化剤 (例えばチオニルクロリド又は塩化水素等を例示できる。) 1～10 当量で塩素化することにより、一般式 [IV-1] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは n -ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系におけ

る還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(3-2)では一般式 [IV-1] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [IV-3] で表される化合物 1～10 当量を不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [IV-4] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

又、工程(3-3)では一般式 [III-3] で表される化合物 1 当量と、一般式 [IV-8] で表される化合物 1～10 当量を、塩基 1～10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [IV-2] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いはピリジン等のピリジン類を例示できる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビスクロ [5.4.0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終

了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

更に、工程(3-4)では一般式 [IV-2] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [IV-3] で表される化合物 2~10 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [IV-4] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコールなどのアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(3-5)では一般式 [III-3] で表される化合物 1 当量を、不活性溶媒中、三フッ素化ホウ素ジエチルエーテル錯体、トリフェニルホスフィン及びトリフルオロ酢酸の存在下又は非存在下、トシルアジド、アジ化ジフェニルホスホリル、アジ化ナトリウム、アジ化リチウム又はアジ化水素などのアジド化剤 1~10 当量でアジド化することにより、一般式 [IV-5] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、或いは *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(3-6)では一般式 [IV-5] で表される化合物 1 当量に対し、マグネシウム、

水素化アルミニウムリチウム、水素化ホウ素ナトリウム、トリフェニルホスフィン又は鉄などの還元剤 1~10 当量を使用、或いはパラジウム炭素、白金炭素又はラネーニッケルなどの触媒を使う水素化接触還元を行うことにより、不活性溶媒中で、一般式 [IV-6] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、メチルアルコール又はエチルアルコール等のアルコール類、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10℃ から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~24 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(3-7)では一般式 [IV-6] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [IV-7] で表される化合物 1~10 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [IV-4] で表される化合物を得ることができる。

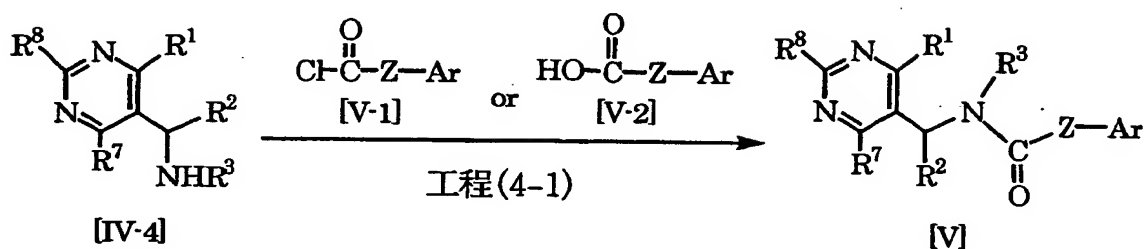
ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、メチルアルコール又はエチルアルコール等のアルコール類、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム tert-ブトキシド等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10℃ から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~24 時間で終

了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 4>



(式中、R¹、R²、R³、R⁷、R⁸、Z 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(4-1)では一般式 [IV-4] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [V-1] で表される化合物 1~10 当量を、不活性溶媒中、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下で反応させるか、或いは、一般式 [IV-4] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [V-2] で表される化合物 1~10 当量を、縮合剤 (例えば 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドヒドロクロリド又は 1,1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール等を例示できる。) 1~10 当量の存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [V] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

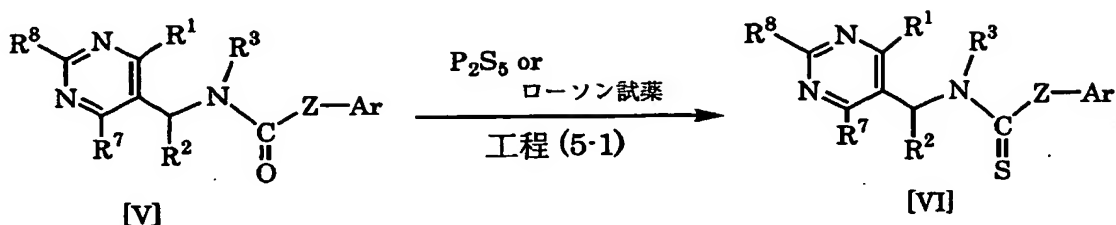
ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いはアセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒を例示できる。

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等の無機塩基類、或いはピリジン又はトリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

何れの反応も場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~100

時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 5>



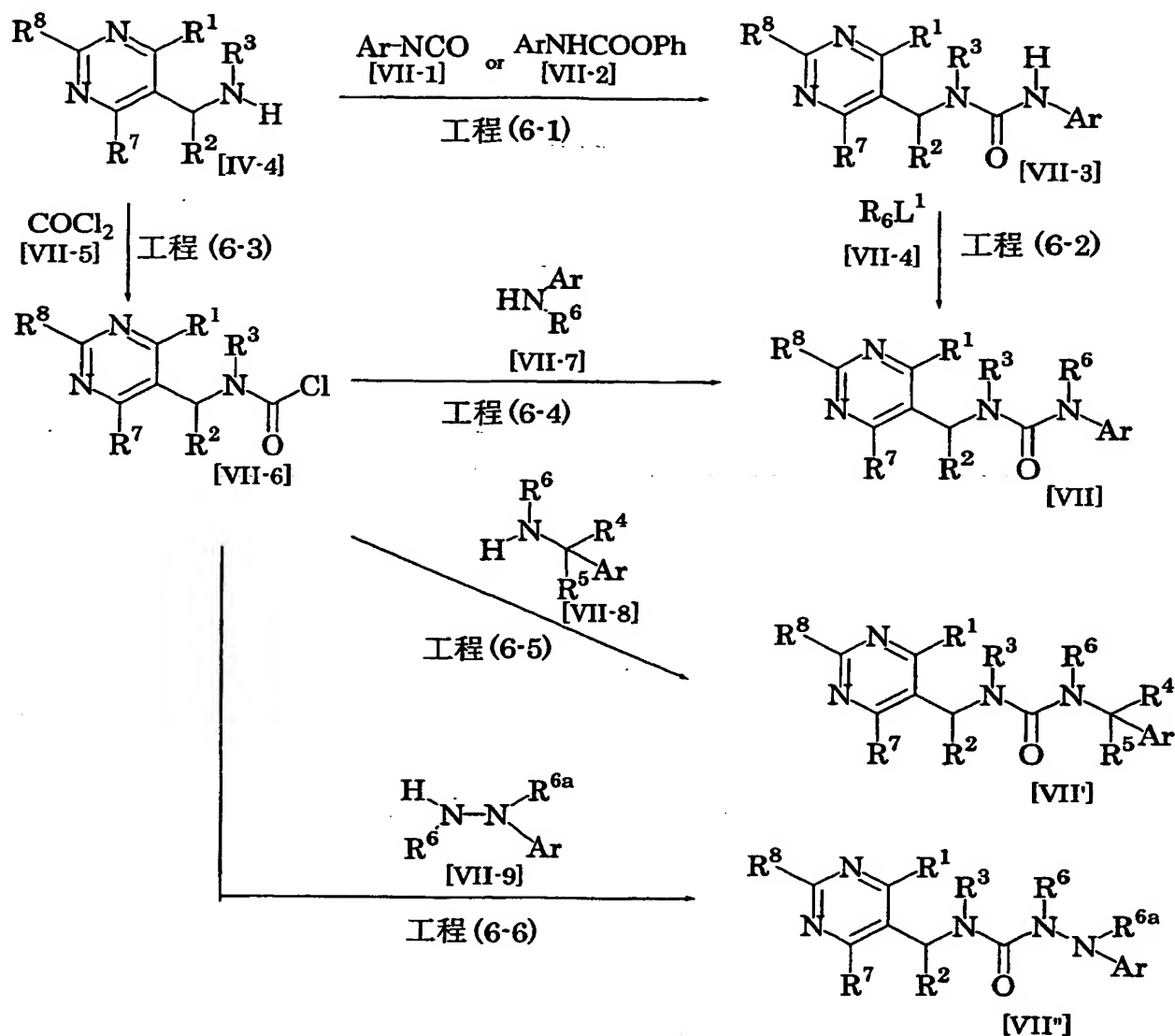
(式中、R¹、R²、R³、R⁷、R⁸、Z 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(5-1)では一般式 [V] で表される本発明化合物 1 当量を、不活性溶媒中、五硫化二リン又はローソン試薬 0.3~10 当量と反応させることにより、一般式 [VI] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えば n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いはピリジン等のピリジン類等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 6>



(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R^{6a}、R⁷、R⁸、Ar 及び L¹ はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(6-1)では一般式 [IV-4] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [VII-1] で表される化合物又は一般式 [VII-2] で表される化合物 0.5~5 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [VII-3] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザ-ビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素

ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、メチルアルコール、イソプロピルアルコール又はエチルアルコール等のアルコール類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(6-2)では一般式 [VII-3] で表される本発明化合物 1 当量に対し、一般式 [VII-4] で表される化合物 1~10 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [VII] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留

又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(6-3)では一般式 [IV-4] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [VII-5] で表される化合物 1~10 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [VII-6] で表される化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、メチルアルコール又はエチルアルコール等のアルコール類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(6-4)、工程(6-5)及び工程(6-6)では一般式 [VII-6] で表される化合物 1 当量に対し、それぞれ一般式 [VII-7] で表される化合物、一般式 [VII-8] で表される化合物及び一般式 [VII-9] で表される化合物 1~10 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [VII] で表される本発明化合物、一般式 [VII'] で表される化合物及び一般式 [VII''] で表される化合物を得ることができる。

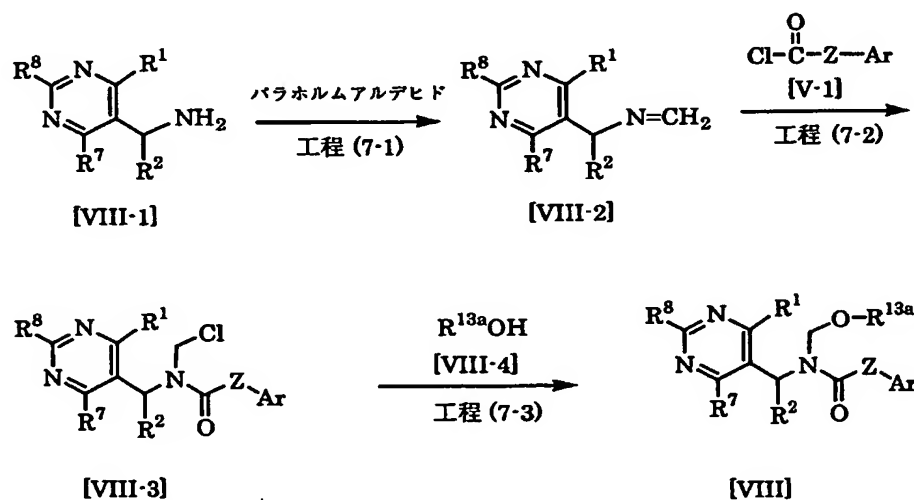
塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素

ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 7>



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^7 、 R^8 、Z 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表わし、 R^{13a} は C1～C6 アルキル基を表す。)

即ち、工程(7-1)では一般式 [VIII-1] で表される化合物 1 当量を、不活性溶媒中、パラホルムアルデヒド 1～10 当量と反応させることにより(条件により、デ

イーンスタークの使用又は触媒を添加する)、一般式 [VIII-2] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えば *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

触媒としては、例えばトリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に工程(7-2)では一般式 [VIII-2] で表される化合物1当量を、[V-1] で表される化合物1～10当量と不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [VIII-3] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えば *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

更に工程(7-3)では一般式 [VIII-3] で表される化合物1当量を、塩基1～10当量の存在下又は非存在下、一般式 [VIII-4] で表される化合物1～4当量と不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [VIII] で表される本発明化合物を得ることができる。

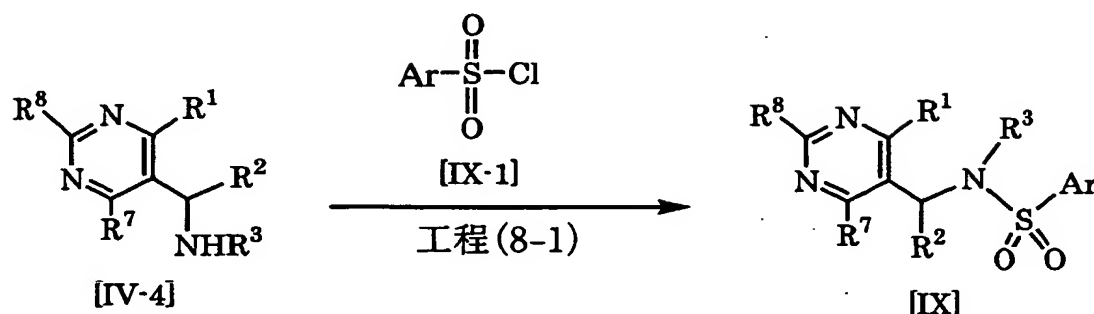
ここで不活性溶媒としては、例えば *n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等の無機塩基類、或いはピリジン又はトリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終

了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 8>



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

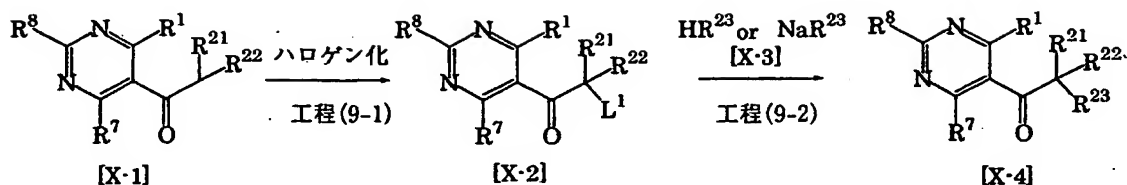
即ち、工程(8-1)では一般式[IV-4]で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [IX-1] で表される化合物 1～10 当量を、不活性溶媒中、塩基 1～10 当量の存在下又は非存在下で反応させることにより、一般式 [IX]で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等の無機塩基類、或いはピリジン又はトリエチルアミン等の有機塩基類を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、 N,N -ジメチルホルムアミド又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、 n -ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間～100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 9>



(式中、R¹、R⁷、R⁸及びL¹はそれぞれ前記と同じ意味を表し、R²¹及びR²²は水素原子又はC1～C6アルキル基を表わし、R²³はC1～C6アルコキシ基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルキニル基、C1～C6アルキルチオ基、シアノ基又はNR⁹R¹⁰を表わし、R⁹及びR¹⁰はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

即ち、工程(9-1)では一般式 [X-1] で表される化合物 1 当量を、不活性溶媒中、塩素化剤 (例えばスルフリルクロリド、N-クロロスクシンイミド又は塩素等を例示できる。) 1～10 当量でハロゲン化することにより、一般式 [X-2] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばクロロホルム又はジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(9-2)では一般式 [X-2] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [X-3] で表される化合物 1～10 当量を、塩基 1～10 当量の存在下又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [X-4] で表される化合物を得ることができる。

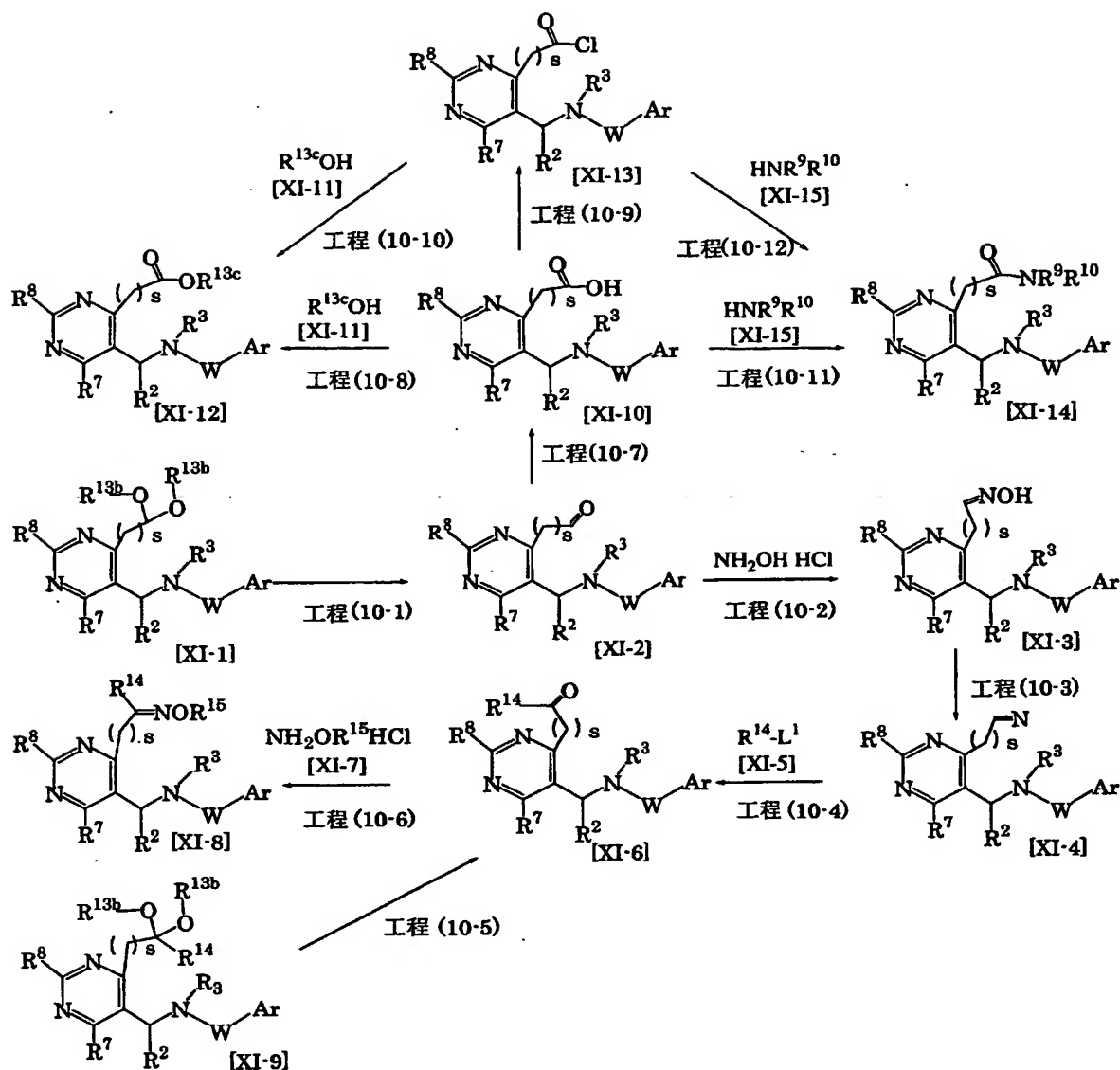
塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナト

リウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 10>



(式中、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 W 、 L^1 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R^{13b} は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基又は互いに結合していてもよい $\text{C}1\sim\text{C}4$ 飽和炭素鎖を表わし、 R^{13c} は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基を表し、 R^{14} 及び R^{15} は水素原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基又は $\text{C}3\sim\text{C}6$ シクロアルキル基を表わし、 s は 0 又は 1 を表わす。)

即ち、工程(10-1)では一般式 [XI-1] で表される化合物 1 当量に対し、塩酸又は硫酸等の酸 0.9~20 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XI-2] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、アセトン又はメチルエチルケトン等のケトン類、水、或いはそれらの混液を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-2)では一般式 [XI-2] で表される本発明化合物 1 当量に対し、ヒドロキシアミン塩酸塩 1～10 当量を、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウムの存在下、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-3] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-3)では一般式 [XI-3] で表される化合物 1 当量に対し、脱水剤 1～10 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XI-4] で表される本発明化合物を得ることができる。

脱水剤としては 1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、1, 1'-カルボニルジイミダゾール、チオニルクロライド、五塩化リン、メタンスルホニルクロライド、ジホスゲン、p-トルエンスルホン酸クロライド、又は無水酢酸等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、又は四塩

化炭素等のハロゲン化炭素類、エチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-4)では、一般式 [XI-4] で表される本発明化合物 1 当量に対し、一般式 [XI-5] で表される化合物 1～10 当量と、メチルリチウム、エチルリチウム又は n-ブチルリチウム等のアルキルリチウム、或いはマグネシウム 1～10 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-6] で表される化合物を得ることができる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

又、工程(10-5)では、一般式 [XI-9] で表される本発明化合物 1 当量に対し、塩酸又は硫酸等の酸 0.9～20 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XI-6] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、アセトン又はメチルエチルケトン等のケトン類、水、或いはそれらの混液を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終

了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-6)では一般式 [XI-6] で表される本発明化合物 1 当量に対し、1～10 当量の酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム存在下、一般式 [XI-7] で表される化合物 1～10 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-8] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間～100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-7)では一般式 [XI-2] で表される本発明化合物 1 当量に対し、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等の塩基 1～10 当量の存在又は非存在下、過マンガン酸カリウム、過酢酸、過酸化水素、m-クロロ過安息香酸又は次亜塩素酸ナトリウムなどの酸化剤 1～10 当量を不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XI-10] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばアセトン又はメチルエチルケトン等のケトン類、エチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、水、或いはそれらの混液を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間～100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-8)では一般式 [XI-10] で表される本発明化合物 1 当量に対し、硫酸、p-トルエンスルホン酸等の存在下、一般式 [XI-11] で表される化合物 1 ~50 当量を、不活性溶媒中又は無溶媒で、反応させることにより一般式 [XI-12] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

工程(10-9)では一般式 [XI-10] で表される本発明化合物 1 当量に対し、チオニルクロライドなどの塩素化剤 1~10 当量を、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-13] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、又は四塩化炭素等のハロゲン化炭素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、或いは n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間~100 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(10-10)では、一般式 [XI-13] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [XI-11] で表される化合物 1~3 当量を、塩基 1~6 当量の存在又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-12] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザ

ビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

又、工程(10-11)では、一般式 [XI-10] で表される本発明化合物 1 当量に対し、一般式 [XI-15] で表される化合物 1～3 当量を、塩基 1～6 当量の存在又は非存在下、1,1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール、又はN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミドなどのペプチド化剤を使用することにより、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-14] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭素類、エチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジ

メチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

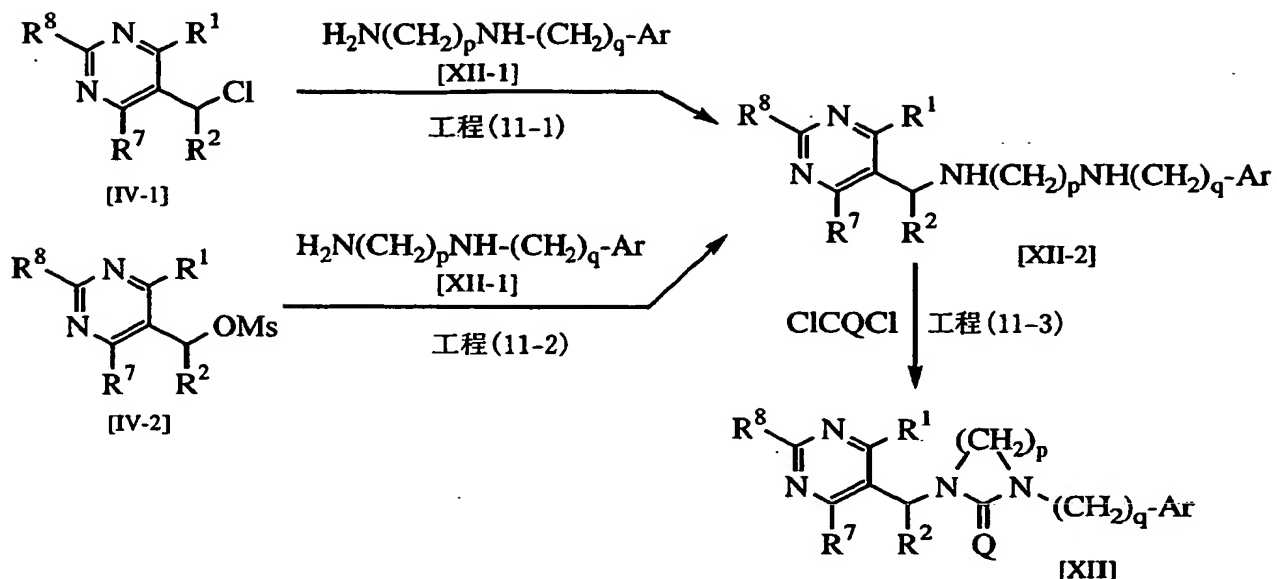
工程(10-12)では、一般式 [XI-13] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [XI-15] で表される化合物 1～3 当量を、塩基 1～10 当量の存在又は非存在下、不活性溶媒中で反応させることにより一般式 [XI-14] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は室温から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～100時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 11>



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^7 、 R^8 、 Q 及び Ar はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 Ms はメタンスルホニル基、 p は 2、3 又は 4 を表わし、 q は 1 又は 0 を表わす。)

即ち、工程(11-1)及び工程(11-2)では一般式 [IV-1] で表される化合物又は一般式 [IV-2] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [XII-1] で表される化合物 0.9~3 当量を、塩基 1~10 当量の存在下又は非存在下で、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XII-2] で表される化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

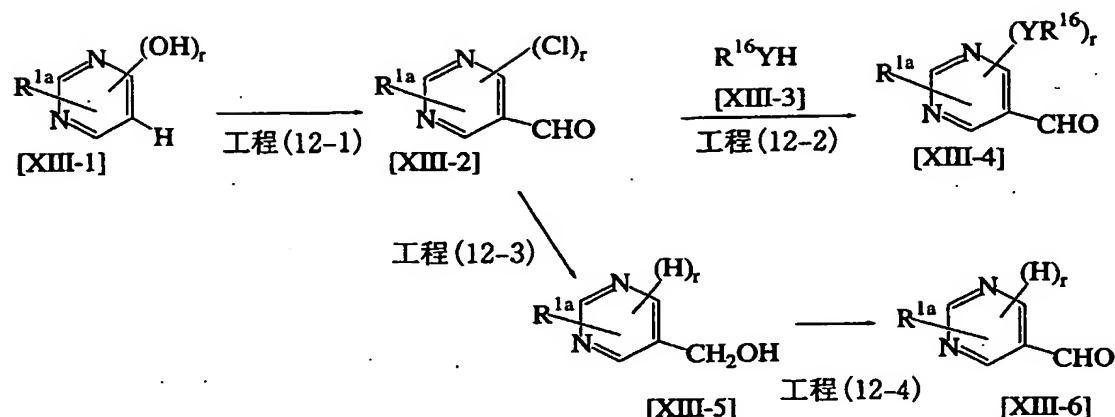
次に、工程(11-3)では一般式 [XII-2] で表される化合物 1 当量に対し、ホスゲン又はチオホスゲン 1～10 当量を、塩基 1～10 当量の存在下又は非存在下で、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XII] で表される目的の本発明化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム又は四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間～24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

<製造法 12>



(式中、 R^{1a} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、フェニル基又は C1～C4 ハロアルキル基を表わし、 R^{16} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、フェニル基を表わし、Y は酸素原子、イオウ原子又は NR^9 を表わし、 R^9 は前記と同じ意味を表わし、r は 1 または 2 を表わす。)

即ち、工程(12-1)では一般式 [XIII-1] で表される化合物 1 当量に対し、N-メチルホルムアニリド又は N,N-ジメチルホルムアミド 1～10 当量とオキシ塩化リン 1～20 当量を、不活性溶媒中又は無溶媒で反応させることにより、一般式 [XIII-2] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム又は四塩化炭素、クロロベンゼン、又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は -10°C から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが 1 時間～24 時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(12-2)では一般式 [XIII-2] で表される化合物 1 当量に対し、一般式 [XIII-3] で表される化合物 1～3 当量を使用することにより、塩基 1～10 当量

の存在下又は非存在下で、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XIII-4] で表される化合物を得ることができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、ピリジン、トリエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウム *tert*-ブトキシド等を例示できる。

ここで溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

また、工程(12-3)では一般式 [XIII-2] で表される化合物 1 当量に対し、酸化マンガン 1~8 当量とパラジウム炭素又はラネーニッケルなどの触媒 0. 01~4 当量を使用することにより、水素添加を行い、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 [XIII-5] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばエチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、*n*-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類又は水を例示できる。

反応温度は-10℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、工程(12-4)では一般式 [XIII-5] で表される化合物 1 当量に対し、不活性溶媒中でオキザリルクロリド 1~10 当量、ジメチルスルホキシド 1~10 当量、及びトリエチルアミン 1~10 当量などを使用する酸化反応を行うことにより、一般式 [XIII-6] で表される化合物を得ることができる。

ここで不活性溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、又は四塩化炭素等のハロゲン化炭素類、エチルアルコール、イソプロピルアルコール又はメチルアルコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、又はジメチルスルホキシド等の非プロトン性極性溶媒、n-ヘキサン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ピリジン等のピリジン類、或いは水を例示できる。

反応は場合により窒素気流下で実施され、反応温度は-80℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、化合物により異なるが1時間~24時間で終了する。目的物は反応液から常法により単離することができ、必要に応じて蒸留又はカラムクロマトグラフィーにて精製する。

次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の合成中間体の製造法も併せて記載する。

<製造例 1>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルアセトアミド (本発明化合物番号 1-8) の製造
4-トリフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン 6 g (2.6 ミリモル) 及び炭酸カリウム 3.6 g (2.6 ミリモル) をアセトニトリル 150 ml に溶解し、フェニルアセチルクロリド 4 g (2.6 ミリモル) を滴下し、室温にて3時間攪拌した。反応溶液に水 200 ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗結晶を n-ヘキサンにて洗浄し、無色透明結晶 (融点 106~109℃) の N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルアセトアミド 7.7 g

(収率85%)を得た。

<製造例2>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-2-ピリジルアセトアミド(本発明化合物番号2-3)の製造
2-ピリミジニル酢酸塩酸塩0.3g(1.7ミリモル)及びトリエチルアミン0.18g(1.8ミリモル)をテトラヒドロフラン30mlに溶解し、1,1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール0.28g(1.7ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。次に4-トリフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン0.4g(1.7ミリモル)を加え、さらに3時間加熱還流した。反応溶液に水100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル:メタノール=4.5:4.5:1)で精製し、無色透明結晶(融点99~100℃)のN-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-2-ピリジルアセトアミド0.2g(収率33%)を得た。

<製造例3>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルチオアセトアミド(本発明化合物番号1-142)の製造

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルアセトアミド0.45g(1.3ミリモル)及びローソン試薬0.52g(1.3ミリモル)をトルエン30mlに溶解し、30時間加熱還流した。反応溶液に水100mlを加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1)で精製し、淡黄色結晶(融点93~94℃)のN-メチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]フェニルチオアセトアミド0.12g(収率26%)を得た。

<製造例 4>

N-メトキシメチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-4-クロロフェニルアセトアミド (本発明化合物番号 1-105) の製造

4-トリフルオロメチル-5-[1-アミノ-2-メチルプロピル]ピリミジン 1.0 g (4.6 ミリモル)、パラホルムアルデヒド 0.23 g (6.9 ミリモル) 及び トリエチルアミン 0.1 g (9.9 ミリモル) をトルエン 50 ml に溶解した。反応系からディーンスタークで脱水しながら 1 時間加熱還流した。反応溶液を室温に戻し、4-クロロフェニルアセチルクロリド 0.86 g (4.6 ミリモル) を滴下し、さらに 2 時間攪拌した。この溶液に、メタノール 0.2 g (6.2 ミリモル) 及び トリエチルアミン 0.5 g (4.9 ミリモル) のトルエン溶液 10 ml を滴下し、室温で 1 時間攪拌した。反応溶液に水 100 ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1) で精製し、無色透明結晶 (融点 142~145℃) の N-メトキシメチル-N-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-4-クロロフェニルアセトアミド 0.5 g (収率 26%) を得た。

<製造例 5>

N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-N-(4-メチルフェニル)ウレア (本発明化合物番号 1-37) の製造

4-クロロジフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリミジン 0.50 g (2.1 ミリモル) 及び 4-メチルフェニルイソシアナート 0.28 g (2.1 ミリモル) をイソプロピルエーテル 30 ml に溶解し、室温にて 1 時間攪拌した。析出した結晶をろ別し、無色透明結晶 (融点 135~137℃) の N-メチル-N-[2-メチル-1-(4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル)プロピル]-N-(4-メチルフェニル)ウレア 0.65 g (収率 84%) を得た。

<製造例 6>

1, 3-ジメチル-1-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル)-プロピル]-3-フェニルウレア (本発明化合物番号 1-4 2 4) の製造

4-トリフルオロメチル-5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]ピリジン 0.8 g (3.4 ミリモル) をクロロホルム 30 ml に溶解し、フェニルイソシアネート 0.45 g (3.8 ミリモル) のクロロホルム溶液 5 ml を滴下し、室温にて 10 時間攪拌した。反応溶液に水 50 ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機相を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗結晶を n-ヘキサンにて洗浄し、1-メチル-1-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル)-プロピル]-3-フェニルウレア 1.0 g (収率 83%) を得た。得られた 1-メチル-1-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル)-プロピル]-3-フェニルウレア 0.5 g (1.4 ミリモル) をテトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、水素化ナトリウム 0.06 g (2.5 ミリモル) を加え室温にて 0.5 時間攪拌した後、沃化メチル 0.22 g (1.6 ミリモル) を滴下し、室温にて 4 時間攪拌した。反応溶液に水 50 ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機相を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン: 酢酸エチル 9:1~3:1) により精製し、無色結晶 (融点 104-105℃) 1, 3-ジメチル-1-[2-メチル-1-(4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル)-プロピル]-3-フェニルウレア 0.28 g (収率 53.8%) を得た。

<製造例 7>

N-[1-(4-エチル-ピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-4-フルオロ-N-メチル-ベンゼンスルホンアミド (本発明化合物番号 4-3) の製造

[1-(4-エチル-ピリミジン-5-イル)-プロピル]-メチル-アミン 0.4 g (0.2 ミリモル) をピリジン 20 ml に溶解し、p-フルオロベンゼンスルホンクロリド 0.43 g (0.22 ミリモル) を滴下し、室温にて 10 時間攪拌した。反

応溶液に水 50 ml を加えジエチルエーテルにより抽出した。得られた有機相を希クエン酸水溶液 30 ml で 2 回洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ジエチルエーテルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルクロマトグラフィー（展開溶媒/*n*-ヘキサン：酢酸エチル 4：1～1：1）により精製し、無色油状物（ $n_D^{20} = 1.5399$ ）（N-[1-（4-エチル-ピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピル]-4-フルオロ-N-メチル-ベンゼンスルホンアミド 0.4 g（収率 56%）を得た。

<製造例 8>

1-（4-クロロベンジル）-1, 3ジメチル-3-〔2-メチル-1-（4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル）-プロピル〕-ウレア（本発明化合物番号 1-532）の製造

（4-クロロベンジル）-メチルアミン 0.16 g（1.0 ミリモル）をピリジン 30 ml に溶解し、N-メチル-N-〔2-メチル-1-（4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル）-プロピル〕-カルバモイルクロリド 0.3 g（1.0 ミリモル）を滴下し、室温にて 10 時間攪拌した。反応溶液に水 50 ml を加えジエチルエーテルにより抽出した。得られた有機相を希クエン酸水溶液 30 ml で 2 回洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ジエチルエーテルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルクロマトグラフィー（展開溶媒/*n*-ヘキサン：酢酸エチル = 8：1～3：1）により精製し、無色結晶（融点 95-98℃）1-（4-クロロベンジル）-1, 3ジメチル-3-〔2-メチル-1-（4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル）-プロピル〕-ウレア 0.22 g（収率 52%）を得た。

<製造例 9>

N-[1-（4-ジエトキシメチルピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピル]-N-メチル-2-フェニル酢酸アミド（本発明化合物番号 1-453）の製造
[1-（4-ジエトキシメチルピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピル]メチルアミン 8.3 g（0.031 モル）、炭酸カリウム 6.4 g（46 ミリモル）をアセトニトリル 100 ml に加えた後、フェニルアセチルクロライド 5.8 g（0.038 モル）を室温下で加え 2 時間反応させた。反応終了後水にあげ、酢

酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：5～酢酸エチル）で精製して、無色粘濁液体（ $n_D^{20}=1.5253$ ）N-[1-(4-ジエトキシメチルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチル-2-フェニル酢酸アミドを8.4 g（収率70%）得た。

<製造例10>

N-[1-(4-ホルミルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチル-4-フルオロフェニルアセトアミド（本発明化合物番号1-523）の製造

N-[1-(4-ジエトキシメチルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチル-4-フルオロフェニルアセトアミド8.4 g（2.1ミリモル）をアセトン100 mlに溶解し、6 N-塩酸13 mlを加え室温で5時間反応させた。反応終了後、反応液を濃縮し、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にして酢酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：5～酢酸エチル）で精製して、無色粘濁液体（ $n_D^{20}=1.5466$ ）のN-[1-(4-ホルミルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチル-4-フルオロフェニルアセトアミドを5.3 g（収率77%）得た。

<製造例11>

N-[1-(4-ヒドロキシイミノメチルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミド（本発明化合物番号1-500）の製造

N-[1-(4-ホルミルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミド1.0 g（3.2ミリモル）をメタノール30 mlに溶解し、ヒドロキシルアミン塩酸塩0.45 g（6.5ミリモル）、酢酸カリウム0.63 g（6.4ミリモル）を加えて室温下で1時間反応させた。反応終了後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、クエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をシリカゲルカ

ラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1～酢酸エチル）で精製して、無色結晶（融点 171～172℃）のN-[1-(4-ヒドロキシイミノメチルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミドを0.45 g（収率43%）得た。

<製造例12>

N-[1-(4-シアノピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミド（本発明化合物番号1-504）の製造

N-[1-(4-ヒドロキシイミノメチルピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミド0.25 g（0.77ミリモル）をクロロホルム30 mlに溶解し、1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩0.16 g（0.83ミリモル）を加え、室温下で8時間反応させた。反応終了後、溶媒を留去し水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1～酢酸エチル）で精製して、無色結晶（融点 80～81℃）のN-[1-(4-シアノピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチルフェニルアセトアミドを0.19 g（収率88%）得た。

<製造例13>

2-(4-クロロフェニル)-N-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピル]-N-メチル酢酸アミド（本発明化合物番号3-41）の製造

1-(4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-2-メチルプロピルアミン0.80 g（3.8ミリモル）、ヨウ化メチル0.59 g（4.2ミリモル）、トリエチルアミン0.46 g（4.6ミリモル）をN,N-ジメチルアセトアミド10 mlに加え、80℃で1時間反応させた。反応終了後水にあげ、トルエンで抽出した。有機層を水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物を精製せずに次反応に供した。この油状物0.20 g（0.89ミリモル）、炭酸カリウム0.22 g（1.6ミリモル）をアセトニトリル20 mlに加えた後、4-クロロフェニルアセチルクロライド0.30 g（1.6ミリモル）を室温下に加え

一晩反応させた。反応終了後水にあけ、酢酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物を分取HPLC（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1）で精製して、無色結晶（融点107～109℃）の2-（4-クロロフェニル）-N-[1-（4，6-ジメトキシピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピル]-N-メチル酢酸アミド0.21g（収率15%、2 steps）得た。

<製造例14>

1-[2-メチル-1-（4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル）-プロピル]-3-フェニルイミダゾリン-2-オン（本発明化合物番号5-1）の製造

5-（1-クロロ-2-メチルプロピル）-4-トリフルオロメチルピリミジン1.05g（4.2モル）、N-フェニルエチレンジアミン0.61（4.2モル）をイソプロピルアルコール10mlに加え、室温で6時間攪拌させた。反応終了後、反応液を濃縮した後、水にあけ、酢酸エチルで抽出し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1～酢酸エチル）で精製して、N-[2-メチル-1-（4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル）-プロピル]-N'-フェニルエタン-1，2-ジアミン0.38gを得た。次にN-[2-メチル-1-（4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル）-プロピル]-N'-フェニルエタン-1，2-ジアミン0.38g（1ミリモル）、トリエチルアミン0.5g（5ミリモル）をジクロロメタン10mlに加え、氷冷下ホスゲン0.2g（2ミリモル）を含んだジクロロメタン溶液を滴下した。滴下後、さらに室温で1時間攪拌し、反応を終了した。反応終了後水にあけ、重曹水で洗浄し、乾燥、濃縮し、得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1～酢酸エチル）で精製して、無色結晶（融点126～128℃）の1-[2-メチル-1-（4-トリフルオロメチル-ピリミジン-5-イル）-プロピル]-3-フェニルイミダゾリン-2-オン0.25g（収率61%）得た。

<製造例15>

5-（1-[[2-（4-クロロフェニル）-プロピオニル]メチルアミノ]-2

ーメチルプロピル)ーピリミジンー4ーカルボン酸(本発明化合物番号1ー718)の製造

Nー[1ー(4ーホルミルピリミジンー5ーイル)ー2ーメチルプロピル]ーNーメチルフェニルアセトアミド1.0g(3.2ミリモル)、テトラヒドロフラン10ml溶液を水酸化カリウム0.23g(4.1ミリモル)、水10mlの溶液に加えた後に、さらに過マンガンカリウム0.88g(5.56ミリモル)を加えた。次に80℃で3時間加温した。反応終了後、亜硫酸ナトリウムを加えた後にろ過を行い、ろ液を塩酸で酸性にして、酢酸エチルで抽出し、塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮を行ない粗生成物を得た。この粗生成物をトルエン、エーテル、アセトン混液に溶解し、水酸化カリウム水溶液で抽出を行った後に、希塩酸で酸性にして、酢酸エチルで抽出を行い、硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮しさらにイソプロピルエーテルで洗浄を行い、淡褐色結晶(融点168ー170℃)の5ー(1ー{[2ー(4ークロロフェニル)ープロピオニル]メチルアミノ}ー2ーメチルプロピル)ーピリミジンー4ーカルボン酸(ジアステレオマーA体)0.33g(収率32%)を得た。

<製造例16>

5ー(1ー{[2ー(4ークロロフェニル)ープロピオニル]メチルアミノ}ー2ーメチルプロピル)ーピリミジンー4ーカルボン酸メチルエステル(ジアステレオマーA体)(本発明化合物番号1ー592)の製造

濃硫酸数滴を5ー(1ー{[2ー(4ークロロフェニル)ープロピオニル]メチルアミノ}ー2ーメチルプロピル)ーピリミジンー4ーカルボン酸2.00g(5.32ミリモル)、メタノール溶液に加え、加熱還流を5時間行った。反応終了後、水を加え酢酸エチルで抽出を行い、塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥、濃縮を行い、得られた油状物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:nーヘキサン=1:1~酢酸エチル)で精製して、無色油状物の5ー(1ー{[2ー(4ークロロフェニル)ープロピオニル]メチルアミノ}ー2ーメチルプロピル)ーピリミジンー4ーカルボン酸メチルエステル(ジアステレオマーA体)0.59g(収率28%)を得た。

(中間体の製造例)

<参考例 1>

3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオンの製造

1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン 213g (1.17 モル)、オルトギ酸エチル 242g (1.64 モル) 及び無水酢酸 166g (1.63 モル) の混合物を 6 時間加熱還流した。溶媒を減圧下留去し、3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン 146g (収率 67%) を得た。

<参考例 2>

5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジンの製造

ナトリウムメトキシド 46g (0.85 モル) をメタノール 700ml に溶解し、ホルムアミジン酢酸塩 76g (0.73 モル) を加え室温で 15 分攪拌した。次に 3-エトキシメチレン-1,1,1-トリフルオロ-5-メチル-2,4-ヘキサンジオン 146g (0.61 モル) を氷冷下に加え、さらに 2 時間加熱還流した。溶媒を減圧下留去し、氷水 1000ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、得られた粗製物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=6:1) で精製し、淡黄色液体の 5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジン 89g (収率 67%) を得た。

<参考例 3>

5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-イソプロピルカルボニル-4-トリフルオロメチルピリミジン 25g (115 ミリモル) をエタノール 100ml に溶解し、氷冷下、ボラン-tert-ブチルアミン錯体 6g (69 ミリモル) を加え 2 時間攪拌した。さらにアセトン 20ml を加え、0.5 時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=1:1) で精製し、淡黄色液体 ($n_D^{20}=1.4481$) の 5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-トリフ

ルオロメチルピリミジン 2.2 g (収率 87%) を得た。

<参考例 4>

5-(1-クロル-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジン 2.2 g (1.00 ミリモル) をクロロホルム 150 ml に溶解し、チオニルクロリド 2.5 ml (3.42 ミリモル) を加えた。反応混合物を 2 時間加熱還流した。溶媒及びチオニルクロリドを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル = 6:1) で精製し、褐色液体 (屈折率 n_D^{20} : 1.4558) の 5-(1-クロル-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジン 1.16 g (収率 49%) を得た。

<参考例 5>

5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-(1-クロル-2-メチルプロピル)-4-トリフルオロメチルピリミジン 4.5 g (1.9 ミリモル) をイソプロピルアルコール 50 ml に溶解し、50%メチルアミン水溶液 10 ml (1.61 ミリモル) を加え、室温にて 8 時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、水 100 ml を加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、淡黄色液体 (屈折率 n_D^{20} : 1.4529) の 5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-トリフルオロメチルピリミジン 3.4 g (収率 77%) を得た。

<参考例 6>

4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオンの製造

2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン 17.2 g (1.10 ミリモル)、オルトギ酸エチル 22.8 g (1.53 ミリモル) 及び無水酢酸 31.5 g (3.09 ミリモル) の混合物を 2 時間 110℃ で反応させた。溶媒を減圧下留去し、4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン 11.5 g (収率 49%) を得た。

<参考例 7>

5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジンの製造

28%ナトリウムメトキシド溶液11.5g(60ミリモル)をメタノール100mlに溶解し、ホルムアミジン酢酸塩5.6g(54ミリモル)を加え、室温で15分攪拌した。次に4-エトキシメチレン-2,6-ジメチル-3,5-ヘプタンジオン11.5g(54ミリモル)を氷冷下で加えた。反応混合物をさらに50℃にて1時間反応させた。溶媒を減圧下留去し、水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒/*n*-ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製し、淡黄色液体の5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジン9.2g(収率89%)を得た。

<参考例8>

5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジンの製造

5-イソプロピルカルボニル-4-イソプロピルピリミジン9.2g(48ミリモル)をエタノール50mlに溶解し、氷冷下、ボラン-*tert*-ブチルアミン錯体2.5g(29ミリモル)を加え2時間攪拌した。さらにアセトン20mlを加え0.5時間攪拌した。溶媒を減圧下留去し、水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジン8.3g(収率89%)の目的物を得た。

<参考例9>

5-(1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジンの製造

5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジン8.3g(43ミリモル)をピリジン10mlに溶解し、氷冷下、メチルスルホニルクロリド9.8g(86ミリモル)を滴下した。反応混合物を室温にて2時間反応させた後、氷水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層をクエン酸水溶液、水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、5-(1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジン10.6g(収率90%)を得た。

[$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3 , TMS δ (ppm)) 0.91 (3H, d), 1.14 (3H, d), 1.31 (3H, dd), 2.1–2.2 (1H, m), 2.89 (3H, s), 3.2–3.3 (3H, m), 5.56 (1H, d), 8.68 (1H, s), 9.14 (1H, s)]

<参考例10>

5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-イソプロピルピリミジンの製造

5-(1-メチルスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-イソプロピルピリミジン10.6g(39ミリモル)をイソプロピルアルコール50mlに溶解し、40%メチルアミン水溶液10ml(129ミリモル)を加え、室温にて8時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧下留去し、水100mlを加え酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒=酢酸エチル)で精製し、淡黄色結晶(融点37~39℃)の5-[1-(N-メチルアミノ)-2-メチルプロピル]-4-イソプロピルピリミジン2.9g(収率36%)を得た。

<参考例11>

5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-メチルチオピリミジンの製造

5-ブロモ-4-メチルチオピリミジン10.6g(52ミリモル)をテトラヒドロフラン100mlに溶解し、-60℃にてn-ブチルリチウムヘキサン溶液(1.6mol/l)36mlを滴下した。-60℃で30分攪拌した後、イソブチルアルデヒド4.1g(57ミリモル)を滴下し、さらに1時間反応させた。反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。酢酸エチルを減圧下留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒/n-ヘキサン:酢酸エチル=3:2)で精製し、淡黄色結晶(融点123~127℃)の5-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-メチルチオピリミジン2.9g(収率28%)を得た。

<参考例12>

2-ブロモ-1-(4-エチルピリミジン-5-イル)-プロパン-1-オンの製造

1-(4-エチルピリミジン-5-イル)プロパン-1-オン49.2g(0.30モル)を四塩化炭素500mlに溶解し、N-ブロモスクシンイミド53g(0.30モル)、アゾイソブチロニトリル0.3gを加え、2時間還流させた。放冷後、結晶をろ過して除き、ろ液を濃縮して得られた油状物をカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4~1:2)で精製して、黄色液体の2-ブロモ-1-(4-エチルピリミジン-5-イル)-プロパン-1-オンを64.3g(収率89%)得た。

<参考例13>

1-(4-エチルピリミジン-5-イル)-2-メチルチオ-プロパン-1-オンの製造

2-ブロモ-1-(4-エチルピリミジン-5-イル)プロパン-1-オン10.0g(0.041モル)をイソプロピルアルコール40mlの溶解し、15%メチルメルカプタンナトリウム水溶液21g(0.045モル)を氷冷下で加えたのち、室温で1時間反応させた。反応終了後水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を塩水で洗浄、乾燥、濃縮して粗製の1-(4-エチルピリミジン-5-イル)-2-メチルチオ-プロパン-1-オン9.5gを得た。精製せずに次反応に供した。

<参考例14>

4,6-ジクロロピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造

N,N-ジメチルホルムアミド65.0g(0.89モル)に氷冷下、20℃以下でオキシ塩化リン356g(2.3モル)を加え、室温で10分攪拌した。4,6-ジヒドロキシピリミジン50.0g(0.45モル)を氷冷下でゆっくりと加えた。添加終了後、温度上昇がおさまったら90℃で3時間反応させた。過剰のオキシ塩化リンを減圧留去し、クロロホルム300mlを加え、氷水中にゆっくり加えた。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた粗結晶をn-ヘキサンで洗浄して褐色結晶(融点65~66℃)の4,6-ジクロロピリミジン-5-カルボアルデヒドを43.8g(収率55%)

得た。

<参考例 15>

4, 6-ジメトキシピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造

4, 6-ジクロロピリミジン-5-カルボアルデヒド 43.6 g (246 ミリモル) をメタノール 200 ml に溶解し、28% ナトリウムメトキシド 120 g (622 ミリモル) を氷冷下で加えた後、室温下で2時間反応させた。反応終了後、溶媒を留去しクエン酸水溶液を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、クエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた粗結晶をイソプロピルエーテルで洗浄して4, 6-ジメトキシピリミジン-5-カルボアルデヒドを8.3 g (収率20%) 得た。

<参考例 16>

1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-3-メチルブタン-2-オール
の製造

マグネシウム 0.81 g (33 ミリモル) をテトラヒドロフラン 30 ml に加え、2-ブロモプロパン 4.1 g (33 ミリモル) を加えてイソプロピルマグネシウムプロマイドのテトラヒドロフラン溶液を調製した。4, 6-ジメトキシピリミジン-5-カルボアルデヒド 2.8 g (17 ミリモル) をテトラヒドロフラン 50 ml に溶解し、上記のテトラヒドロフラン溶液を室温下で加え一晩反応させた。反応液を塩化アンモニウム水溶液にあげ酢酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン=1:4) で精製して、淡黄色結晶の1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-3-メチルブタン-2-オールを1.9 g (収率54%) 得た。

<参考例 17>

5-(2-アジド-3-メチルブチル)-4, 6-ジメトキシピリミジンの製造

1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-5-イル)-3-メチルブタン-2-オール 1.05 g (5 ミリモル) をトルエン 10 ml に溶解し、氷冷下でトリメチルシリルアジド 1.01 g (10 ミリモル) と三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 1.42 g (10 ミリモル) を順に加えた後、室温下で7時間反応させた。

反応終了後、水にあけ、トルエンで抽出した。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：9）で精製して、無色液体の5-（2-アジド-3-メチルブチル）-4,6-ジメトキシピリミジンを1.22 g（収率100%）得た。

[$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3 , TMS δ (ppm)) 0.70 (3H, d)、1.13 (3H, d)、2.44 (1H, m)、4.00 (6H, s)、4.38 (1H, d)、8.39 (1H, s)]

<参考例18>

1-（4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピルアミンの製造

5-（2-アジド-3-メチルブチル）-4,6-ジメトキシピリミジン1.2 g（5.1ミリモル）をメタノール20 mlに溶解し、氷冷下でマグネシウム1.5 g（0.062モル）を加え、一晚反応させた。反応終了後、溶媒を留去しエーテルを加えて不溶物をろ過し、希塩酸で抽出した。水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性としトルエンで抽出した。有機層を水、塩水の順で洗浄、乾燥、濃縮して得られた油状物をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：1）で精製して、無色結晶の1-（4,6-ジメトキシピリミジン-5-イル）-2-メチルプロピルアミン0.80 g（収率75%）得た。

[$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3 , TMS δ (ppm)) 0.70 (3H, d)、1.07 (3H, d)、1.71 (2H, s)、2.02 (1H, m)、3.78 (1H, d)、3.97 (6H, s)、8.33 (1H, s)]

次に製造法1から製造法12に記載の方法に準じて製造した本発明化合物の物性値（ $^1\text{H-NMR}$ 値（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）を表40から表43に示す。

表 40

| 化合物 番号 | NMR (δ (ppm), 300MHz, TMS- CDCl_3) |
|-----------|---|
| 1-016 | 0. 81 (3H, d)、1. 01 (3H, d)、2. 75-2. 87 (1H, m)、2. 90 (1H, s)、3. 60 (2H, dd)、3. 78 (3H, s)、5. 44 (1H, d)、6. 83 (2H, d)、7. 11 (2H, d)、9. 23 (1H, s)、9. 25 (1H, s) |
| 1-034 | 0. 29-0. 32 (1H, m)、0. 75-0. 77 (3H, m)、1. 48-1. 60 (1H, m)、2. 99 (3H, s)、3. 70 (2H, s)、4. 84 (1H, d)、7. 17-7. 33 (5H, m)、9. 25 (1H, s)、9. 31 (1H, s) |
| 1-195 | 0. 76-0. 81 (3H, t、3H, t)、0. 91-0. 98 (3H, t、3H, t)、1. 36-1. 41 (3H, d、3H, d)、2. 64-2. 90 (1H, m、1H, m)、2. 75 (3H, s)、2. 85 (3H, s)、3. 69-3. 80 (1H, q、1H, q)、5. 13 (1H, d)、5. 51 (1H, d)、7. 17-7. 31 (5H, m、5H, m)、9. 22 (1H, s)、9. 23 (1H, s)、9. 27 (1H, s)、9. 30 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |
| 1-329 | 0. 80 (3H, d)、1. 07 (3H, d)、1. 45 (3H, s)、1. 50 (3H, s)、2. 39 (3H, s)、2. 67-2. 80 (1H, m)、5. 58 (1H, d)、7. 08 (2H, d)、7. 25 (2H, d)、9. 15 (1H, s)、9. 27 (1H, s) |
| 1-488 | 2. 76 (3H, s)、2. 88 (3H, s)、3. 70 (3H, s)、3. 72 (3H, s)、3. 77 (2H, s)、3. 79 (2H, s)、7. 36-7. 73 (9H, m、9H, m)、8. 57 (1H, s)、8. 61 (1H, s)、9. 25 (1H, s)、9. 27 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |
| 1-490 | 2. 76 (3H, s)、2. 88 (3H, s)、3. 70 (3H, s)、3. 72 (3H, s)、3. 77 (2H, s)、3. 79 (2H, s)、6. 70-7. 40 (8H, m、8H, m)、8. 55 (1H, s)、8. 60 (1H, s)、9. 25 (1H, s)、9. 27 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |
| 1-526 | 0. 89 (3H, d)、0. 98 (3H, d)、2. 48-2. 60 (1H, m)、2. 68 (3H, s)、2. 92 (3H, s)、3. 63 (2H, s)、5. 38 (1H, d)、7. 05-7. 28 (5H, m)、8. 94 (1H, s)、9. 13 (1H, s) |

表 41

| 化合物 番号 | NMR (δ (ppm), 300MHz, TMS- CDCl_3) |
|-----------|--|
| 1-562 | 0. 79 (3H, d)、0. 89 (3H, d)、0. 89 (3H, d)、 1. 12 (3H, t)、1. 16 (3H, d)、1. 29 (3H, t)、 1. 25 (3H, d)、1. 52 (3H, d)、1. 88 (1H, t)、 2. 27 (1H, t)、2. 04-2. 94 (3H, m、3H, m)、3. 44-3. 56 (1H, m、1H, m)、3. 69-3. 81 (2H, m)、3. 90-4. 00 (2H, m)、5. 77 (2H, d、2H, d)、7. 19-7. 35 (5H, m、5H, m)、8. 59 (1H, s)、8. 61 (1H, s)、9. 00 (1H, s)、9. 08 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |
| 1-592 | 0. 90 (3H, d)、1. 01 (3H, d)、1. 36 (3H, d)、 2. 53-2. 65 (1H, m)、2. 73 (3H, s)、3. 78 (1 H, q)、4. 01 (3H, s)、5. 70 (1H, d)、6. 99 (2 H, d)、7. 18 (2H, d)、8. 89 (1H, s)、9. 16 (1 H, s) |
| 1-593 | 0. 80 (3H, d)、0. 92 (3H, d)、1. 36 (3H, d)、 2. 40-2. 50 (1H, m)、2. 62 (3H, s)、3. 68 (1 H, q)、4. 02 (3H, s)、5. 76 (1H, d)、7. 14 (2 H, d)、7. 27 (2H, d)、8. 92 (1H, s)、9. 19 (1 H, s) |
| 1-595 | 0. 80 (3H, d)、0. 91 (3H, d)、1. 35 (3H, d)、 1. 45 (3H, t)、2. 40-2. 50 (1H, m)、2. 63 (3 H, s)、3. 67 (1H, q)、4. 51 (2H, q)、5. 78 (1 H, d)、7. 14 (2H, d)、7. 27 (2H, d)、8. 92 (1 H, s)、9. 19 (1H, s) |
| 1-651 | 0. 94 (3H, t、3H, t)、1. 47 (3H, d)、1. 66 (3 H, d)、1. 88-1. 98 (2H, m、2, m)、2. 08 (3H, s)、2. 09 (3H, s)、2. 61 (3H, s)、2. 68 (3H, s)、3. 74 (2H, dd、2H, dd)、4. 29 (1H, q、1H, q)、6. 03 (1H, t)、6. 12 (1H, t)、7. 23-7. 37 (5H, m、5H, m)、8. 61 (1H, s)、8. 63 (1H, s)、 9. 09 (1H, s)、9. 11 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |
| 1-652 | 0. 94 (3H, t、3H, t)、1. 49 (3H, d)、1. 65 (3 H, d)、1. 91-1. 99 (2H, m、2H, m)、2. 07 (3H, s)、2. 63 (3H, s)、2. 70 (3H, s)、3. 70 (2H, s、2H, s)、4. 25-4. 32 (1H, m、1H, m)、6. 01 (1H, t)、6. 11 (1H, t)、6. 99-7. 28 (4H, m、4 H, m)、8. 62 (1H, s)、8. 64 (1H, s)、9. 10 (1 H, s)、9. 11 (1H, s)、ジアステレオマー混合物 |

表 42

| 化合物 番号 | NMR (δ (ppm), 300MHz, TMS- CDCl_3) |
|-----------|---|
| 1-872 | 0. 77 (3H, d)、0. 97 (3H, d)、1. 37 (3H, d)、 2. 85 (3H, s)、2. 81-2. 91 (1H, m)、3. 77 (1 H, q) 5. 14 (1H, d)、7. 16-7. 29 (5H, m) 9. 22 (1H, s)、9. 29 (1H, s) |
| 1-873 | 0. 80 (3H, d)、1. 15 (3H, d)、2. 43 (3H, s)、 2. 76-2. 84 (1H, m)、3. 18 (3H, s)、5. 23 (1 H, d)、6. 77 (2H, d)、7. 02 (1H, t)、7. 15 (2 H, d) 9. 16 (1H, s)、9. 26 (1H, s) |
| 1-877 | 0. 82 (3H, t)、0. 93 (3H, t)、1. 72 (3H, s)、 1. 78 (3H, s)、1. 86-1. 92 (2H, m)、2. 77 (3 H, s)、3. 01 (3H, s)、3. 70 (2H, s)、4. 06 (2 H, s)、3. 70-4. 20 (4H, m)、5. 86 (1H, t)、6. 09 (1H, t)、7. 14-7. 30 (4H, m)、8. 70 (1H, s)、8. 80 (1H, s)、9. 13 (1H, s)、9. 22 (1H, s) |
| 1-878 | 0. 89 (3H, t)、0. 97 (3H, t)、1. 70-1. 90 (2 H, m)、1. 90-2. 10 (2H, m)、2. 66 (3H, s)、2. 70 (3H, s)、2. 94 (3H, s)、3. 00 (3H, s)、3. 6 2 (2H, s)、3. 73 (2H, dd)、5. 62 (1H, t)、5. 7 0-5. 79 (1H, m)、7. 05-7. 27 (4H, m、4H, m)、 8. 68 (1H, s)、8. 83 (1H, s)、9. 15 (1H, s)、 9. 20 (1H, s) |
| 2-58 | 0. 44-0. 53 (2H, m)、0. 55-0. 65 (H, m)、1. 16 (3H, s)、3. 13 (3H, s)、3. 80 (2H, s)、5. 6 4 (1H, s)、6. 63 (1H, d)、6. 75 (1H, d)、9. 12 (1H, s)、9. 26 (1H, s) |
| 2-75 | 0. 89 (3H, d)、0. 99 (3H, d)、1. 23 (3H, t)、 2. 43-2. 51 (1H, m)、2. 71-3. 05 (2H, m)、2. 77 (3H, s)、3. 80 (2H, dd)、5. 72 (1H, d)、6. 65 (1H, d)、6. 74 (1H, d)、8. 61 (1H, s)、9. 0 6 (1H, s) |

表 43

| 化合物 番号 | NMR (δ (ppm), 300MHz, TMS- CDCl_3) |
|-----------|--|
| 4-26 | 0. 78 (3H, t)、1. 11-1. 21 (3H, m)、1. 31 (3H, t)、2. 36 (3H, s)、2. 58 (3H, s)、2. 44-2. 67 (1H, m)、2. 77 (3H, s)、2. 86 (3H, s)、2. 88-3. 16 (2H, m)、5. 02 (1H, dd)、7. 04-7. 45 (4H, m)、8. 52 (1H, s)、8. 69 (1H, s)、9. 01 (1H, s)、9. 10 (1H, s) |
| 4-28 | 0. 77 (3H, d)、1. 15 (3H, d)、1. 31 (3H, t)、2. 31 (3H, s)、2. 33-2. 43 (1H, m) 2. 80 (3H, s)、2. 89-3. 17 (2H, m)、5. 02 (1H, d)、7. 22-7. 35 (4H, m)、8. 52 (1H, s)、9. 01 (1H, s) |
| 4-36 | 0. 77 (3H, d)、1. 12 (3H, d)、2. 48-2. 58 (1H, m)、3. 04 (3H, s)、5. 09 (1H, d)、7. 35-7. 39 (2H, m)、7. 46-7. 54 (3H, m) 9. 05 (1H, s)、9. 21 (1H, s) |
| 4-37 | 0. 77 (3H, d)、1. 13 (3H, d)、2. 53-2. 59 (1H, m)、3. 02 (3H, s)、5. 1 (1H, d)、7. 04-7. 08 (2H, m)、7. 54-7. 58 (2H, m) 9. 06 (1H, s)、9. 24 (1H, s) |
| 4-54 | 0. 86 (3H, t)、1. 34 (3H, t)、1. 63-2. 09 (2H, m)、2. 76 (3H, s)、2. 91-3. 09 (2H, m)、5. 27 (1H, dd) 7. 17-7. 21 (2H, m) 7. 72-7. 79 (2H, m)、8. 47 (1H, s)、9. 06 (1H, s) |
| 5-13 | 0. 79 (3H, d)、1. 16 (3H, d)、1. 83-1. 90 (2H, m)、2. 91-2. 99 (1H, m)、3. 07-3. 14 (3H, m)、3. 32-3. 40 (1H, m)、4. 40 (1H, d)、4. 68 (1H, d)、5. 02 (1H, d) 7. 20-7. 33 (5H, m)、9. 25 (1H, s)、9. 46 (1H, s) |

本発明の除草剤は、一般式〔I〕で示されるピリミジン誘導体を有効成分としてなる。

本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤または補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、微粒剤または粒剤等に製剤して使用することもできる。

製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫酸、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

界面活性剤及び分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリアルスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するかまたは直接施用する。

本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用または水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤または粒剤とする場合は0.01～10%（重量）、好ましくは0.05～5%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合は1～50%（重量）、好ましくは5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。

本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそのまま使用する場合は、有効成分として10アール当たり0.1g～5kg、好ましくは1g～1kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合のように液状で使用する場合は、0.1～50,000ppm、好ましくは10～10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

また、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長

調節剤、肥料等と混用してもよい。

次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

〈製剤例 1〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉碎し、水和剤を得る。

〈製剤例 2〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、クレーの64部を混合粉碎し、水和剤を得る。

〈製剤例 3〉 水和剤

化合物(1-8)の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 β -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイトカーボンの5部、炭酸カルシウムの64部を混合粉碎し、水和剤を得る。

〈製剤例 4〉 乳剤

化合物(1-8)の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得る。

〈製剤例 5〉 粒剤

化合物(1-8)の10部、タルクとベントナイトを1:3の割合の混合した増量剤で80部、ホワイトカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリアルポリマー及びアルキルアリアルスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるい穴から押し出して乾燥した後に0.5~1mmの長さに切断し、粒剤を得る。

次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

〈試験例1〉 水田湛水処理による除草効果試験

100cm²プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ(Eo)、コナギ(Mo)の種子を播種し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を10アール当り100gとした。その後、温室内で育成し、処理後21日目に表44の基準に従って除草効果を調査した。結果を表45~表52に示す。

表 44

| 指数 | 除草効果（生育抑制程度）及び葉害 |
|----|--------------------|
| 5 | 90%以上の抑制の除草効果、葉害 |
| 4 | 70%以上90%未満の除草効果、葉害 |
| 3 | 50%以上70%未満の除草効果、葉害 |
| 2 | 30%以上50%未満の除草効果、葉害 |
| 1 | 10%以上30%未満の除草効果、葉害 |
| 0 | 0%以上10%未満の除草効果、葉害 |

表 45

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | EO | MO |
|-------|--------------|----|----|
| 1-4 | 100 | 5 | 5 |
| 1-8 | 100 | 5 | 5 |
| 1-9 | 100 | 5 | 5 |
| 1-10 | 100 | 5 | 5 |
| 1-12 | 100 | 5 | 5 |
| 1-13 | 100 | 5 | 5 |
| 1-15 | 100 | 5 | 5 |
| 1-16 | 100 | 5 | 5 |
| 1-17 | 100 | 5 | 5 |
| 1-18 | 100 | 5 | 5 |
| 1-19 | 100 | 5 | 5 |
| 1-20 | 100 | 5 | 5 |
| 1-21 | 100 | 5 | 5 |
| 1-22 | 100 | 5 | 5 |
| 1-23 | 100 | 5 | 5 |
| 1-24 | 100 | 5 | 5 |
| 1-25 | 100 | 5 | 5 |
| 1-26 | 100 | 5 | 5 |
| 1-27 | 100 | 5 | 5 |
| 1-32 | 100 | 5 | 5 |
| 1-33 | 100 | 5 | 5 |
| 1-34 | 100 | 5 | 5 |
| 1-35 | 100 | 5 | 5 |
| 1-36 | 100 | 5 | 5 |
| 1-37 | 100 | 5 | 5 |
| 1-38 | 100 | 5 | 5 |
| 1-39 | 100 | 5 | 5 |
| 1-40 | 100 | 5 | 5 |
| 1-41 | 100 | 5 | 5 |
| 1-42 | 100 | 5 | 5 |
| 1-43 | 100 | 5 | 5 |
| 1-44 | 100 | 5 | 5 |
| 1-45 | 100 | 5 | 5 |
| 1-46 | 100 | 5 | 5 |
| 1-47 | 100 | 5 | 5 |
| 1-48 | 100 | 5 | 5 |
| 1-49 | 100 | 5 | 5 |
| 1-50 | 100 | 5 | 5 |
| 1-51 | 100 | 5 | 5 |
| 1-52 | 100 | 5 | 5 |
| 1-53 | 100 | 5 | 5 |
| 1-54 | 100 | 5 | 5 |
| 1-55 | 100 | 5 | 5 |
| 1-56 | 100 | 5 | 5 |
| 1-57 | 100 | 5 | 5 |
| 1-58 | 100 | 5 | 5 |
| 1-59 | 100 | 5 | 5 |
| 1-60 | 100 | 5 | 5 |
| 1-61 | 100 | 5 | 5 |
| 1-62 | 100 | 5 | 5 |
| 1-63 | 100 | 5 | 5 |
| 1-64 | 100 | 5 | 5 |
| 1-65 | 100 | 5 | 5 |

表 46

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | EO | MO |
|-------|--------------|----|----|
| 1-66 | 100 | 5 | 5 |
| 1-67 | 100 | 5 | 5 |
| 1-68 | 100 | 5 | 5 |
| 1-70 | 100 | 5 | 5 |
| 1-71 | 100 | 5 | 5 |
| 1-72 | 100 | 5 | 5 |
| 1-74 | 100 | 5 | 5 |
| 1-75 | 100 | 5 | 5 |
| 1-76 | 100 | 5 | 5 |
| 1-78 | 100 | 5 | 5 |
| 1-80 | 100 | 5 | 5 |
| 1-81 | 100 | 5 | 5 |
| 1-82 | 100 | 5 | 5 |
| 1-83 | 100 | 5 | 5 |
| 1-84 | 100 | 5 | 5 |
| 1-85 | 100 | 5 | 5 |
| 1-86 | 100 | 5 | 5 |
| 1-87 | 100 | 5 | 5 |
| 1-88 | 100 | 5 | 5 |
| 1-89 | 100 | 5 | 5 |
| 1-90 | 100 | 5 | 5 |
| 1-91 | 100 | 5 | 5 |
| 1-93 | 100 | 5 | 5 |
| 1-94 | 100 | 5 | 5 |
| 1-95 | 100 | 5 | 5 |
| 1-96 | 100 | 5 | 5 |
| 1-97 | 100 | 5 | 5 |
| 1-98 | 100 | 5 | 5 |
| 1-99 | 100 | 5 | 5 |
| 1-100 | 100 | 5 | 5 |
| 1-101 | 100 | 5 | 5 |
| 1-102 | 100 | 5 | 5 |
| 1-103 | 100 | 5 | 5 |
| 1-104 | 100 | 5 | 5 |
| 1-105 | 100 | 5 | 5 |
| 1-106 | 100 | 5 | 5 |
| 1-107 | 100 | 5 | 5 |
| 1-111 | 100 | 5 | 4 |
| 1-112 | 100 | 5 | 5 |
| 1-113 | 100 | 5 | 5 |
| 1-114 | 100 | 5 | 5 |
| 1-115 | 100 | 5 | 5 |
| 1-116 | 100 | 5 | 5 |
| 1-118 | 100 | 5 | 5 |
| 1-119 | 100 | 5 | 5 |
| 1-120 | 100 | 5 | 5 |
| 1-121 | 100 | 5 | 5 |
| 1-122 | 100 | 5 | 5 |
| 1-123 | 100 | 5 | 5 |
| 1-124 | 100 | 5 | 5 |
| 1-125 | 100 | 5 | 5 |
| 1-126 | 100 | 5 | 5 |
| 1-127 | 100 | 5 | 5 |

表 47

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Eo | Mo |
|-------|--------------|----|----|
| 1-128 | 100 | 5 | 4 |
| 1-129 | 100 | 5 | 5 |
| 1-130 | 100 | 5 | 5 |
| 1-131 | 100 | 5 | 5 |
| 1-132 | 100 | 5 | 5 |
| 1-133 | 100 | 5 | 5 |
| 1-134 | 100 | 5 | 5 |
| 1-135 | 100 | 5 | 5 |
| 1-136 | 100 | 5 | 5 |
| 1-137 | 100 | 5 | 5 |
| 1-138 | 100 | 5 | 5 |
| 1-139 | 100 | 5 | 5 |
| 1-140 | 100 | 5 | 5 |
| 1-141 | 100 | 5 | 5 |
| 1-142 | 100 | 5 | 5 |
| 1-143 | 100 | 5 | 5 |
| 1-144 | 100 | 5 | 5 |
| 1-145 | 100 | 5 | 5 |
| 1-146 | 100 | 5 | 5 |
| 1-147 | 100 | 5 | 5 |
| 1-148 | 100 | 5 | 5 |
| 1-150 | 100 | 5 | 5 |
| 1-151 | 100 | 5 | 5 |
| 1-152 | 100 | 5 | 5 |
| 1-153 | 100 | 5 | 5 |
| 1-154 | 100 | 5 | 5 |
| 1-155 | 100 | 5 | 5 |
| 1-156 | 100 | 5 | 5 |
| 1-159 | 100 | 5 | 5 |
| 1-160 | 100 | 5 | 5 |
| 1-161 | 100 | 5 | 5 |
| 1-162 | 100 | 5 | 5 |
| 1-163 | 100 | 5 | 5 |
| 1-164 | 100 | 5 | 5 |
| 1-165 | 100 | 5 | 5 |
| 1-166 | 100 | 5 | 5 |
| 1-167 | 100 | 5 | 5 |
| 1-168 | 100 | 5 | 5 |
| 1-169 | 100 | 5 | 5 |
| 1-170 | 100 | 5 | 5 |
| 1-171 | 100 | 5 | 5 |
| 1-172 | 100 | 5 | 5 |
| 1-173 | 100 | 5 | 5 |
| 1-174 | 100 | 5 | 5 |
| 1-175 | 100 | 5 | 5 |
| 1-177 | 100 | 5 | 5 |
| 1-178 | 100 | 5 | 4 |
| 1-180 | 100 | 5 | 5 |
| 1-181 | 100 | 5 | 5 |
| 1-182 | 100 | 5 | 5 |
| 1-183 | 100 | 5 | 5 |
| 1-184 | 100 | 5 | 5 |
| 1-185 | 100 | 5 | 5 |

表 48

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Eo | Mo |
|-------|--------------|----|----|
| 1-186 | 100 | 5 | 5 |
| 1-187 | 100 | 5 | 5 |
| 1-188 | 100 | 5 | 5 |
| 1-189 | 100 | 5 | 5 |
| 1-190 | 100 | 5 | 5 |
| 1-191 | 100 | 5 | 5 |
| 1-192 | 100 | 5 | 5 |
| 1-193 | 100 | 5 | 5 |
| 1-194 | 100 | 5 | 5 |
| 1-195 | 100 | 5 | 5 |
| 1-196 | 100 | 5 | 5 |
| 1-197 | 100 | 5 | 5 |
| 1-198 | 100 | 5 | 5 |
| 1-200 | 100 | 5 | 5 |
| 1-214 | 100 | 5 | 5 |
| 1-217 | 100 | 5 | 5 |
| 1-218 | 100 | 5 | 5 |
| 1-219 | 100 | 5 | 5 |
| 1-220 | 100 | 5 | 5 |
| 1-221 | 100 | 5 | 5 |
| 1-222 | 100 | 5 | 5 |
| 1-225 | 100 | 5 | 5 |
| 1-226 | 100 | 5 | 5 |
| 1-228 | 100 | 5 | 5 |
| 1-234 | 100 | 5 | 5 |
| 1-249 | 100 | 5 | 5 |
| 1-250 | 100 | 5 | 5 |
| 1-251 | 100 | 5 | 5 |
| 1-254 | 100 | 5 | 5 |
| 1-265 | 100 | 5 | 5 |
| 1-266 | 100 | 5 | 5 |
| 1-267 | 100 | 5 | 5 |
| 1-270 | 100 | 5 | 5 |
| 1-273 | 100 | 5 | 5 |
| 1-274 | 100 | 5 | 5 |
| 1-305 | 100 | 5 | 5 |
| 1-306 | 100 | 5 | 5 |
| 1-307 | 100 | 5 | 5 |
| 1-310 | 100 | 5 | 5 |
| 1-321 | 100 | 5 | 5 |
| 1-322 | 100 | 5 | 5 |
| 1-323 | 100 | 5 | 5 |
| 1-324 | 100 | 5 | 5 |
| 1-325 | 100 | 5 | 5 |
| 1-327 | 100 | 5 | 5 |
| 1-328 | 100 | 5 | 5 |
| 1-329 | 100 | 5 | 5 |
| 1-330 | 100 | 5 | 5 |
| 1-331 | 100 | 5 | 5 |
| 1-333 | 100 | 5 | 5 |
| 1-334 | 100 | 5 | 5 |
| 1-335 | 100 | 5 | 5 |
| 1-401 | 100 | 5 | 5 |

表 49

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | EO | MO |
|-------|--------------|----|----|
| 1-402 | 100 | 5 | 5 |
| 1-403 | 100 | 5 | 5 |
| 1-404 | 100 | 5 | 5 |
| 1-407 | 100 | 5 | 5 |
| 1-409 | 100 | 5 | 5 |
| 1-410 | 100 | 5 | 5 |
| 1-411 | 100 | 5 | 5 |
| 1-412 | 100 | 5 | 5 |
| 1-413 | 100 | 5 | 5 |
| 1-414 | 100 | 5 | 5 |
| 1-415 | 100 | 5 | 5 |
| 1-416 | 100 | 5 | 5 |
| 1-417 | 100 | 5 | 5 |
| 1-418 | 100 | 5 | 5 |
| 1-419 | 100 | 5 | 5 |
| 1-420 | 100 | 5 | 5 |
| 1-421 | 100 | 5 | 5 |
| 1-422 | 100 | 5 | 5 |
| 1-424 | 100 | 5 | 5 |
| 1-425 | 100 | 5 | 5 |
| 1-426 | 100 | 5 | 5 |
| 1-427 | 100 | 5 | 5 |
| 1-428 | 100 | 5 | 5 |
| 1-429 | 100 | 5 | 5 |
| 1-430 | 100 | 5 | 5 |
| 1-431 | 100 | 5 | 5 |
| 1-432 | 100 | 5 | 5 |
| 1-433 | 100 | 5 | 5 |
| 1-434 | 100 | 5 | 5 |
| 1-435 | 100 | 5 | 5 |
| 1-436 | 100 | 5 | 5 |
| 1-437 | 100 | 5 | 5 |
| 1-438 | 100 | 5 | 5 |
| 1-439 | 100 | 5 | 5 |
| 1-441 | 100 | 5 | 5 |
| 1-442 | 100 | 5 | 5 |
| 1-443 | 100 | 5 | 5 |
| 1-444 | 100 | 5 | 5 |
| 1-445 | 100 | 5 | 5 |
| 1-446 | 100 | 5 | 5 |
| 1-447 | 100 | 5 | 5 |
| 1-448 | 100 | 5 | 5 |
| 1-449 | 100 | 5 | 5 |
| 1-450 | 100 | 5 | 5 |
| 1-451 | 100 | 5 | 5 |
| 1-452 | 100 | 5 | 5 |
| 1-454 | 100 | 5 | 5 |
| 1-455 | 100 | 5 | 5 |
| 1-458 | 100 | 5 | 5 |
| 1-459 | 100 | 5 | 5 |
| 1-460 | 100 | 5 | 5 |
| 1-461 | 100 | 5 | 5 |
| 1-463 | 100 | 5 | 5 |

表 50

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | EO | MO |
|-------|--------------|----|----|
| 1-464 | 100 | 5 | 5 |
| 1-465 | 100 | 5 | 5 |
| 1-469 | 100 | 5 | 5 |
| 1-473 | 100 | 5 | 5 |
| 1-476 | 100 | 5 | 5 |
| 1-482 | 100 | 5 | 5 |
| 1-483 | 100 | 5 | 5 |
| 1-484 | 100 | 5 | 5 |
| 1-485 | 100 | 5 | 5 |
| 1-486 | 100 | 5 | 5 |
| 1-487 | 100 | 5 | 5 |
| 1-488 | 100 | 5 | 5 |
| 1-489 | 100 | 5 | 5 |
| 1-490 | 100 | 5 | 5 |
| 1-491 | 100 | 5 | 5 |
| 1-492 | 100 | 5 | 5 |
| 1-493 | 100 | 5 | 5 |
| 1-494 | 100 | 5 | 5 |
| 1-495 | 100 | 5 | 5 |
| 1-496 | 100 | 5 | 5 |
| 1-497 | 100 | 5 | 5 |
| 1-498 | 100 | 5 | 5 |
| 1-499 | 100 | 5 | 5 |
| 1-500 | 100 | 5 | 5 |
| 1-501 | 100 | 5 | 5 |
| 1-502 | 100 | 5 | 5 |
| 1-504 | 100 | 5 | 5 |
| 1-505 | 100 | 5 | 5 |
| 1-506 | 100 | 5 | 5 |
| 1-507 | 100 | 5 | 5 |
| 1-510 | 100 | 5 | 5 |
| 1-511 | 100 | 5 | 5 |
| 1-517 | 100 | 5 | 5 |
| 1-518 | 100 | 5 | 5 |
| 1-519 | 100 | 5 | 5 |
| 1-520 | 100 | 5 | 5 |
| 1-521 | 100 | 5 | 5 |
| 1-524 | 100 | 5 | 5 |
| 1-526 | 100 | 5 | 5 |
| 1-527 | 100 | 5 | 5 |
| 1-528 | 100 | 5 | 5 |
| 1-529 | 100 | 5 | 5 |
| 1-530 | 100 | 5 | 5 |
| 1-532 | 100 | 5 | 5 |
| 1-533 | 100 | 5 | 5 |
| 1-535 | 100 | 5 | 5 |
| 1-536 | 100 | 5 | 5 |
| 1-537 | 100 | 5 | 5 |
| 1-538 | 100 | 5 | 5 |
| 1-539 | 100 | 5 | 5 |
| 1-540 | 100 | 5 | 5 |
| 1-541 | 100 | 5 | 5 |
| 1-546 | 100 | 5 | 5 |

表 51

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Eo | Mo |
|-------|--------------|----|----|
| 1-547 | 100 | 5 | 5 |
| 1-548 | 100 | 5 | 5 |
| 1-549 | 100 | 5 | 5 |
| 1-550 | 100 | 5 | 5 |
| 1-551 | 100 | 5 | 5 |
| 1-553 | 100 | 5 | 5 |
| 1-555 | 100 | 5 | 5 |
| 1-558 | 100 | 5 | 5 |
| 1-559 | 100 | 5 | 5 |
| 1-560 | 100 | 5 | 5 |
| 1-561 | 100 | 5 | 5 |
| 1-562 | 100 | 5 | 5 |
| 1-563 | 100 | 5 | 5 |
| 1-565 | 100 | 5 | 5 |
| 1-566 | 100 | 5 | 5 |
| 1-567 | 100 | 5 | 5 |
| 1-569 | 100 | 5 | 5 |
| 1-571 | 100 | 5 | 4 |
| 1-572 | 100 | 5 | 5 |
| 1-573 | 100 | 5 | 5 |
| 1-579 | 100 | 5 | 5 |
| 1-584 | 100 | 5 | 5 |
| 1-586 | 100 | 5 | 5 |
| 1-589 | 100 | 5 | 5 |
| 1-591 | 100 | 5 | 5 |
| 1-592 | 100 | 5 | 5 |
| 1-593 | 100 | 5 | 5 |
| 1-594 | 100 | 5 | 5 |
| 1-595 | 100 | 5 | 5 |
| 1-597 | 100 | 5 | 5 |
| 1-598 | 100 | 5 | 5 |
| 1-599 | 100 | 5 | 5 |
| 1-600 | 100 | 5 | 5 |
| 1-602 | 100 | 5 | 5 |
| 1-603 | 100 | 5 | 5 |
| 1-604 | 100 | 5 | 5 |
| 1-606 | 100 | 5 | 5 |
| 1-607 | 100 | 5 | 5 |
| 1-608 | 100 | 5 | 5 |
| 1-609 | 100 | 5 | 5 |
| 1-611 | 100 | 5 | 5 |
| 1-614 | 100 | 5 | 5 |
| 1-615 | 100 | 5 | 5 |
| 1-624 | 100 | 5 | 5 |
| 1-626 | 100 | 5 | 5 |
| 1-627 | 100 | 5 | 5 |
| 1-637 | 100 | 5 | 5 |
| 1-639 | 100 | 5 | 5 |
| 1-640 | 100 | 5 | 5 |
| 1-641 | 100 | 5 | 5 |
| 2-1 | 100 | 5 | 5 |
| 2-2 | 100 | 5 | 5 |
| 2-3 | 100 | 5 | 5 |

表 52.

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Eo | Mo |
|-------|--------------|----|----|
| 2-5 | 100 | 5 | 5 |
| 2-6 | 100 | 5 | 5 |
| 2-7 | 100 | 5 | 5 |
| 2-8 | 100 | 5 | 5 |
| 2-9 | 100 | 5 | 5 |
| 2-10 | 100 | 5 | 5 |
| 2-11 | 100 | 5 | 5 |
| 2-12 | 100 | 5 | 5 |
| 2-13 | 100 | 5 | 5 |
| 2-14 | 100 | 5 | 5 |
| 2-19 | 100 | 5 | 5 |
| 2-20 | 100 | 5 | 5 |
| 2-23 | 100 | 5 | 5 |
| 2-24 | 100 | 5 | 5 |
| 2-25 | 100 | 5 | 5 |
| 2-31 | 100 | 5 | 5 |
| 2-32 | 100 | 5 | 5 |
| 2-41 | 100 | 5 | 5 |
| 2-42 | 100 | 5 | 5 |
| 2-44 | 100 | 5 | 5 |
| 2-46 | 100 | 5 | 5 |
| 2-48 | 100 | 5 | 5 |
| 2-50 | 100 | 5 | 5 |
| 2-51 | 100 | 5 | 5 |
| 2-52 | 100 | 5 | 5 |
| 2-53 | 100 | 5 | 5 |
| 2-54 | 100 | 5 | 5 |
| 2-55 | 100 | 5 | 5 |
| 2-56 | 100 | 5 | 5 |
| 2-57 | 100 | 5 | 5 |
| 2-58 | 100 | 5 | 5 |
| 2-59 | 100 | 5 | 5 |
| 2-60 | 100 | 5 | 5 |
| 2-61 | 100 | 5 | 5 |
| 2-62 | 100 | 5 | 5 |
| 2-63 | 100 | 5 | 5 |
| 2-71 | 100 | 5 | 5 |
| 2-72 | 100 | 5 | 5 |
| 2-73 | 100 | 5 | 5 |
| 2-74 | 100 | 5 | 5 |
| 2-75 | 100 | 5 | 5 |
| 2-77 | 100 | 5 | 5 |
| 2-78 | 100 | 5 | 5 |
| 2-80 | 100 | 5 | 4 |
| 4-1 | 100 | 5 | 5 |
| 4-2 | 100 | 5 | 5 |

〈試験例2〉 畑地土壌処理による除草効果試験

80 cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ (E c)、エノコログサ (S e) の種子を播種して覆土した。製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、10アール当り有効成分が100 gになる様に、10アール当り100 lを小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表44の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表53～表60に示す。

表 53

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | S |
|-------|--------------|----|---|
| 1-8 | 100 | 5 | 5 |
| 1-9 | 100 | 5 | 5 |
| 1-10 | 100 | 4 | 4 |
| 1-12 | 100 | 5 | 5 |
| 1-13 | 100 | 5 | 5 |
| 1-15 | 100 | 5 | 5 |
| 1-16 | 100 | 4 | 5 |
| 1-17 | 100 | 4 | 4 |
| 1-20 | 100 | 5 | 5 |
| 1-21 | 100 | 5 | 5 |
| 1-22 | 100 | 5 | 5 |
| 1-23 | 100 | 5 | 5 |
| 1-24 | 100 | 5 | 5 |
| 1-25 | 100 | 5 | 5 |
| 1-26 | 100 | 5 | 5 |
| 1-27 | 100 | 5 | 5 |
| 1-32 | 100 | 5 | 5 |
| 1-33 | 100 | 5 | 5 |
| 1-34 | 100 | 5 | 5 |
| 1-35 | 100 | 5 | 5 |
| 1-36 | 100 | 5 | 5 |
| 1-37 | 100 | 5 | 5 |
| 1-38 | 100 | 5 | 4 |
| 1-40 | 100 | 5 | 4 |
| 1-41 | 100 | 5 | 5 |
| 1-42 | 100 | 5 | 5 |
| 1-45 | 100 | 5 | 5 |
| 1-46 | 100 | 5 | 5 |
| 1-47 | 100 | 5 | 5 |
| 1-48 | 100 | 5 | 5 |
| 1-49 | 100 | 5 | 4 |
| 1-50 | 100 | 5 | 5 |
| 1-51 | 100 | 5 | 5 |
| 1-52 | 100 | 5 | 5 |
| 1-53 | 100 | 5 | 5 |
| 1-54 | 100 | 5 | 5 |
| 1-55 | 100 | 5 | 5 |
| 1-56 | 100 | 5 | 5 |
| 1-57 | 100 | 5 | 5 |
| 1-58 | 100 | 5 | 5 |
| 1-59 | 100 | 5 | 5 |
| 1-60 | 100 | 5 | 5 |
| 1-61 | 100 | 5 | 5 |
| 1-62 | 100 | 4 | 4 |
| 1-63 | 100 | 5 | 5 |
| 1-64 | 100 | 5 | 5 |
| 1-65 | 100 | 5 | 5 |
| 1-66 | 100 | 5 | 5 |
| 1-67 | 100 | 5 | 5 |
| 1-68 | 100 | 5 | 5 |
| 1-70 | 100 | 5 | 5 |
| 1-71 | 100 | 5 | 5 |
| 1-72 | 100 | 5 | 4 |

表 54

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-74 | 100 | 5 | 5 |
| 1-75 | 100 | 5 | 5 |
| 1-76 | 100 | 5 | 5 |
| 1-77 | 100 | 5 | 5 |
| 1-78 | 100 | 5 | 5 |
| 1-80 | 100 | 5 | 5 |
| 1-81 | 100 | 5 | 5 |
| 1-83 | 100 | 5 | 5 |
| 1-85 | 100 | 5 | 5 |
| 1-87 | 100 | 5 | 5 |
| 1-88 | 100 | 5 | 5 |
| 1-89 | 100 | 5 | 5 |
| 1-90 | 100 | 5 | 5 |
| 1-91 | 100 | 4 | 5 |
| 1-92 | 100 | 5 | 5 |
| 1-95 | 100 | 5 | 5 |
| 1-96 | 100 | 5 | 5 |
| 1-97 | 100 | 5 | 5 |
| 1-98 | 100 | 5 | 5 |
| 1-99 | 100 | 5 | 5 |
| 1-100 | 100 | 5 | 5 |
| 1-101 | 100 | 5 | 5 |
| 1-102 | 100 | 5 | 5 |
| 1-103 | 100 | 5 | 5 |
| 1-105 | 100 | 5 | 5 |
| 1-106 | 100 | 5 | 4 |
| 1-111 | 100 | 5 | 5 |
| 1-112 | 100 | 5 | 5 |
| 1-113 | 100 | 5 | 4 |
| 1-114 | 100 | 5 | 5 |
| 1-115 | 100 | 5 | 5 |
| 1-116 | 100 | 5 | 4 |
| 1-118 | 100 | 5 | 5 |
| 1-119 | 100 | 5 | 4 |
| 1-120 | 100 | 5 | 4 |
| 1-121 | 100 | 5 | 4 |
| 1-122 | 100 | 5 | 5 |
| 1-123 | 100 | 5 | 5 |
| 1-124 | 100 | 5 | 5 |
| 1-125 | 100 | 5 | 5 |
| 1-126 | 100 | 5 | 5 |
| 1-127 | 100 | 5 | 5 |
| 1-128 | 100 | 5 | 5 |
| 1-130 | 100 | 5 | 5 |
| 1-131 | 100 | 5 | 5 |
| 1-133 | 100 | 5 | 5 |
| 1-134 | 100 | 5 | 5 |
| 1-135 | 100 | 5 | 5 |
| 1-136 | 100 | 5 | 5 |
| 1-137 | 100 | 5 | 5 |
| 1-138 | 100 | 5 | 5 |
| 1-139 | 100 | 5 | 5 |
| 1-140 | 100 | 5 | 5 |

表 55

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-141 | 100 | 5 | 5 |
| 1-142 | 100 | 5 | 5 |
| 1-143 | 100 | 5 | 5 |
| 1-144 | 100 | 5 | 5 |
| 1-145 | 100 | 5 | 5 |
| 1-146 | 100 | 4 | 4 |
| 1-147 | 100 | 5 | 5 |
| 1-148 | 100 | 5 | 5 |
| 1-150 | 100 | 5 | 5 |
| 1-151 | 100 | 5 | 5 |
| 1-152 | 100 | 5 | 5 |
| 1-153 | 100 | 5 | 5 |
| 1-155 | 100 | 4 | 4 |
| 1-159 | 100 | 5 | 5 |
| 1-160 | 100 | 5 | 5 |
| 1-161 | 100 | 5 | 5 |
| 1-162 | 100 | 5 | 4 |
| 1-163 | 100 | 5 | 5 |
| 1-164 | 100 | 5 | 5 |
| 1-165 | 100 | 5 | 5 |
| 1-166 | 100 | 5 | 5 |
| 1-167 | 100 | 5 | 5 |
| 1-168 | 100 | 5 | 5 |
| 1-169 | 100 | 5 | 5 |
| 1-170 | 100 | 5 | 5 |
| 1-171 | 100 | 5 | 4 |
| 1-172 | 100 | 5 | 5 |
| 1-173 | 100 | 5 | 5 |
| 1-174 | 100 | 5 | 5 |
| 1-177 | 100 | 4 | 4 |
| 1-180 | 100 | 5 | 5 |
| 1-181 | 100 | 5 | 5 |
| 1-182 | 100 | 5 | 5 |
| 1-186 | 100 | 5 | 5 |
| 1-187 | 100 | 5 | 5 |
| 1-190 | 100 | 4 | 4 |
| 1-192 | 100 | 5 | 5 |
| 1-193 | 100 | 5 | 5 |
| 1-194 | 100 | 5 | 5 |
| 1-195 | 100 | 5 | 5 |
| 1-196 | 100 | 5 | 5 |
| 1-197 | 100 | 5 | 5 |
| 1-198 | 100 | 5 | 5 |
| 1-200 | 100 | 5 | 5 |
| 1-214 | 100 | 5 | 5 |
| 1-217 | 100 | 5 | 5 |
| 1-218 | 100 | 5 | 5 |
| 1-219 | 100 | 5 | 5 |
| 1-220 | 100 | 5 | 5 |
| 1-222 | 100 | 5 | 5 |
| 1-225 | 100 | 5 | 5 |
| 1-226 | 100 | 5 | 4 |
| 1-228 | 100 | 5 | 5 |

表 56

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-234 | 100 | 5 | 5 |
| 1-249 | 100 | 5 | 5 |
| 1-250 | 100 | 4 | 5 |
| 1-251 | 100 | 5 | 5 |
| 1-254 | 100 | 5 | 5 |
| 1-265 | 100 | 5 | 5 |
| 1-266 | 100 | 5 | 5 |
| 1-267 | 100 | 5 | 5 |
| 1-270 | 100 | 5 | 5 |
| 1-273 | 100 | 5 | 5 |
| 1-274 | 100 | 5 | 5 |
| 1-305 | 100 | 5 | 5 |
| 1-306 | 100 | 5 | 5 |
| 1-307 | 100 | 5 | 5 |
| 1-310 | 100 | 5 | 5 |
| 1-321 | 100 | 5 | 5 |
| 1-323 | 100 | 4 | 4 |
| 1-326 | 100 | 4 | 4 |
| 1-327 | 100 | 5 | 5 |
| 1-328 | 100 | 5 | 5 |
| 1-329 | 100 | 5 | 5 |
| 1-330 | 100 | 5 | 5 |
| 1-331 | 100 | 5 | 5 |
| 1-332 | 100 | 5 | 5 |
| 1-333 | 100 | 5 | 5 |
| 1-334 | 100 | 5 | 5 |
| 1-335 | 100 | 5 | 5 |
| 1-401 | 100 | 5 | 5 |
| 1-402 | 100 | 5 | 5 |
| 1-403 | 100 | 5 | 5 |
| 1-404 | 100 | 5 | 5 |
| 1-407 | 100 | 5 | 5 |
| 1-409 | 100 | 5 | 5 |
| 1-410 | 100 | 5 | 5 |
| 1-411 | 100 | 5 | 5 |
| 1-412 | 100 | 5 | 5 |
| 1-414 | 100 | 4 | 5 |
| 1-416 | 100 | 5 | 5 |
| 1-417 | 100 | 5 | 5 |
| 1-418 | 100 | 5 | 5 |
| 1-419 | 100 | 5 | 5 |
| 1-424 | 100 | 5 | 5 |
| 1-425 | 100 | 5 | 5 |
| 1-426 | 100 | 5 | 5 |
| 1-427 | 100 | 5 | 5 |
| 1-428 | 100 | 5 | 5 |
| 1-429 | 100 | 5 | 5 |
| 1-430 | 100 | 5 | 5 |
| 1-431 | 100 | 5 | 5 |
| 1-432 | 100 | 5 | 5 |
| 1-433 | 100 | 5 | 5 |
| 1-434 | 100 | 5 | 5 |
| 1-435 | 100 | 5 | 5 |

表 57

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-436 | 100 | 5 | 5 |
| 1-437 | 100 | 5 | 5 |
| 1-438 | 100 | 5 | 5 |
| 1-439 | 100 | 5 | 4 |
| 1-441 | 100 | 5 | 5 |
| 1-442 | 100 | 5 | 5 |
| 1-443 | 100 | 5 | 5 |
| 1-444 | 100 | 5 | 5 |
| 1-445 | 100 | 5 | 5 |
| 1-446 | 100 | 5 | 5 |
| 1-447 | 100 | 5 | 5 |
| 1-448 | 100 | 5 | 4 |
| 1-449 | 100 | 5 | 5 |
| 1-450 | 100 | 5 | 5 |
| 1-451 | 100 | 5 | 5 |
| 1-452 | 100 | 5 | 5 |
| 1-454 | 100 | 4 | 5 |
| 1-455 | 100 | 5 | 5 |
| 1-458 | 100 | 5 | 4 |
| 1-459 | 100 | 5 | 5 |
| 1-460 | 100 | 5 | 5 |
| 1-461 | 100 | 5 | 5 |
| 1-463 | 100 | 4 | 5 |
| 1-464 | 100 | 5 | 5 |
| 1-465 | 100 | 5 | 5 |
| 1-466 | 100 | 4 | 4 |
| 1-471 | 100 | 5 | 4 |
| 1-473 | 100 | 5 | 4 |
| 1-476 | 100 | 5 | 5 |
| 1-482 | 100 | 5 | 5 |
| 1-483 | 100 | 5 | 4 |
| 1-484 | 100 | 5 | 5 |
| 1-485 | 100 | 5 | 5 |
| 1-488 | 100 | 5 | 5 |
| 1-489 | 100 | 5 | 5 |
| 1-490 | 100 | 5 | 5 |
| 1-492 | 100 | 5 | 5 |
| 1-493 | 100 | 5 | 5 |
| 1-494 | 100 | 5 | 5 |
| 1-495 | 100 | 5 | 5 |
| 1-496 | 100 | 5 | 4 |
| 1-497 | 100 | 5 | 5 |
| 1-498 | 100 | 5 | 5 |
| 1-499 | 100 | 5 | 4 |
| 1-502 | 100 | 4 | 4 |
| 1-504 | 100 | 5 | 5 |
| 1-505 | 100 | 5 | 5 |
| 1-506 | 100 | 5 | 5 |
| 1-507 | 100 | 5 | 5 |
| 1-508 | 100 | 5 | 5 |
| 1-511 | 100 | 4 | 4 |
| 1-517 | 100 | 5 | 5 |
| 1-518 | 100 | 5 | 5 |

表 58

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-519 | 100 | 5 | 5 |
| 1-520 | 100 | 5 | 5 |
| 1-521 | 100 | 5 | 5 |
| 1-523 | 100 | 4 | 5 |
| 1-524 | 100 | 5 | 5 |
| 1-526 | 100 | 5 | 5 |
| 1-527 | 100 | 5 | 5 |
| 1-528 | 100 | 5 | 5 |
| 1-529 | 100 | 5 | 5 |
| 1-530 | 100 | 5 | 5 |
| 1-531 | 100 | 4 | 4 |
| 1-532 | 100 | 5 | 5 |
| 1-533 | 100 | 5 | 5 |
| 1-535 | 100 | 5 | 5 |
| 1-536 | 100 | 5 | 5 |
| 1-537 | 100 | 5 | 5 |
| 1-538 | 100 | 5 | 5 |
| 1-539 | 100 | 5 | 5 |
| 1-540 | 100 | 5 | 5 |
| 1-541 | 100 | 5 | 4 |
| 1-546 | 100 | 5 | 5 |
| 1-547 | 100 | 5 | 5 |
| 1-548 | 100 | 5 | 5 |
| 1-549 | 100 | 5 | 5 |
| 1-550 | 100 | 5 | 5 |
| 1-551 | 100 | 5 | 5 |
| 1-553 | 100 | 5 | 5 |
| 1-555 | 100 | 5 | 5 |
| 1-558 | 100 | 5 | 5 |
| 1-559 | 100 | 5 | 5 |
| 1-560 | 100 | 5 | 5 |
| 1-561 | 100 | 5 | 4 |
| 1-562 | 100 | 5 | 5 |
| 1-563 | 100 | 5 | 5 |
| 1-565 | 100 | 5 | 5 |
| 1-566 | 100 | 5 | 5 |
| 1-567 | 100 | 5 | 5 |
| 1-569 | 100 | 5 | 5 |
| 1-571 | 100 | 5 | 5 |
| 1-572 | 100 | 5 | 5 |
| 1-573 | 100 | 5 | 4 |
| 1-579 | 100 | 5 | 5 |
| 1-584 | 100 | 5 | 5 |
| 1-586 | 100 | 5 | 5 |
| 1-589 | 100 | 5 | 5 |
| 1-591 | 100 | 5 | 5 |
| 1-592 | 100 | 5 | 5 |
| 1-594 | 100 | 5 | 5 |
| 1-597 | 100 | 4 | 4 |
| 1-598 | 100 | 5 | 4 |
| 1-600 | 100 | 4 | 5 |
| 1-602 | 100 | 5 | 5 |
| 1-603 | 100 | 4 | 4 |

表 59

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 1-604 | 100 | 5 | 4 |
| 1-606 | 100 | 5 | 5 |
| 1-607 | 100 | 4 | 4 |
| 1-608 | 100 | 5 | 5 |
| 1-609 | 100 | 5 | 4 |
| 1-611 | 100 | 5 | 5 |
| 1-614 | 100 | 5 | 5 |
| 1-616 | 100 | 5 | 5 |
| 1-617 | 100 | 5 | 5 |
| 1-618 | 100 | 5 | 5 |
| 1-619 | 100 | 5 | 5 |
| 1-620 | 100 | 5 | 5 |
| 1-621 | 100 | 5 | 5 |
| 1-622 | 100 | 4 | 5 |
| 1-623 | 100 | 5 | 4 |
| 1-624 | 100 | 5 | 5 |
| 1-625 | 100 | 4 | 5 |
| 1-626 | 100 | 5 | 4 |
| 1-627 | 100 | 5 | 5 |
| 1-636 | 100 | 4 | 4 |
| 1-639 | 100 | 5 | 5 |
| 1-640 | 100 | 4 | 4 |
| 1-641 | 100 | 5 | 4 |
| 1-642 | 100 | 4 | 4 |
| 1-646 | 100 | 4 | 4 |
| 2-1 | 100 | 5 | 4 |
| 2-2 | 100 | 5 | 4 |
| 2-6 | 100 | 5 | 4 |
| 2-7 | 100 | 5 | 5 |
| 2-8 | 100 | 5 | 5 |
| 2-9 | 100 | 5 | 5 |
| 2-10 | 100 | 5 | 5 |
| 2-11 | 100 | 5 | 5 |
| 2-12 | 100 | 5 | 5 |
| 2-13 | 100 | 5 | 5 |
| 2-14 | 100 | 5 | 5 |
| 2-19 | 100 | 5 | 5 |
| 2-20 | 100 | 5 | 5 |
| 2-23 | 100 | 5 | 5 |
| 2-24 | 100 | 5 | 5 |
| 2-25 | 100 | 5 | 5 |
| 2-31 | 100 | 5 | 5 |
| 2-32 | 100 | 5 | 5 |
| 2-44 | 100 | 5 | 5 |
| 2-46 | 100 | 5 | 5 |
| 2-47 | 100 | 4 | 5 |
| 2-50 | 100 | 5 | 5 |
| 2-51 | 100 | 5 | 5 |
| 2-52 | 100 | 5 | 5 |
| 2-53 | 100 | 5 | 5 |
| 2-54 | 100 | 5 | 5 |
| 2-55 | 100 | 5 | 5 |
| 2-56 | 100 | 5 | 5 |

表 60

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | Ec | Se |
|-------|--------------|----|----|
| 2-57 | 100 | 5 | 5 |
| 2-58 | 100 | 5 | 5 |
| 2-59 | 100 | 5 | 4 |
| 2-60 | 100 | 5 | 5 |
| 2-61 | 100 | 5 | 5 |
| 2-62 | 100 | 5 | 5 |
| 2-63 | 100 | 5 | 4 |
| 2-71 | 100 | 5 | 5 |
| 2-72 | 100 | 5 | 5 |
| 2-73 | 100 | 5 | 5 |
| 2-74 | 100 | 5 | 5 |
| 2-75 | 100 | 5 | 5 |
| 2-77 | 100 | 5 | 5 |
| 2-78 | 100 | 5 | 5 |
| 2-79 | 100 | 5 | 5 |
| 4-1 | 100 | 5 | 5 |
| 4-2 | 100 | 5 | 4 |

〈試験例 3〉 畑地茎葉処理による除草効果試験

80 cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ (E c)、エノコログサ (S e) の種子を播種し、温室内で2週間育成後、製剤例 1 に準じて調製した水和剤を水に希釈し、10 アール当り有効成分が100 g になる様に、10 アール当り100 l を小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、処理14日目に表 44 の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表 61～表 64 に示す。

表 61

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Ec | Se |
|-------|-------------|----|----|
| 1-1 | 100 | 4 | 4 |
| 1-8 | 100 | 5 | 4 |
| 1-9 | 100 | 5 | 4 |
| 1-10 | 100 | 4 | 4 |
| 1-12 | 100 | 5 | 4 |
| 1-13 | 100 | 5 | 4 |
| 1-21 | 100 | 4 | 4 |
| 1-22 | 100 | 4 | 4 |
| 1-24 | 100 | 4 | 4 |
| 1-26 | 100 | 4 | 4 |
| 1-27 | 100 | 4 | 4 |
| 1-41 | 100 | 5 | 4 |
| 1-42 | 100 | 4 | 4 |
| 1-46 | 100 | 4 | 4 |
| 1-47 | 100 | 4 | 4 |
| 1-48 | 100 | 5 | 4 |
| 1-50 | 100 | 4 | 4 |
| 1-53 | 100 | 4 | 4 |
| 1-54 | 100 | 5 | 4 |
| 1-55 | 100 | 4 | 4 |
| 1-56 | 100 | 4 | 4 |
| 1-57 | 100 | 5 | 4 |
| 1-58 | 100 | 4 | 4 |
| 1-59 | 100 | 4 | 4 |
| 1-60 | 100 | 4 | 4 |
| 1-61 | 100 | 4 | 4 |
| 1-66 | 100 | 5 | 4 |
| 1-78 | 100 | 5 | 4 |
| 1-81 | 100 | 4 | 4 |
| 1-83 | 100 | 5 | 4 |
| 1-87 | 100 | 4 | 4 |
| 1-88 | 100 | 4 | 4 |
| 1-89 | 100 | 5 | 4 |
| 1-92 | 100 | 5 | 4 |
| 1-95 | 100 | 5 | 5 |
| 1-96 | 100 | 5 | 5 |
| 1-98 | 100 | 4 | 4 |
| 1-100 | 100 | 5 | 5 |
| 1-107 | 100 | 4 | 4 |
| 1-111 | 100 | 4 | 4 |
| 1-112 | 100 | 4 | 5 |
| 1-113 | 100 | 4 | 4 |
| 1-122 | 100 | 4 | 4 |
| 1-127 | 100 | 4 | 4 |
| 1-129 | 100 | 5 | 5 |
| 1-133 | 100 | 5 | 4 |
| 1-137 | 100 | 5 | 4 |
| 1-142 | 100 | 4 | 4 |
| 1-143 | 100 | 4 | 4 |
| 1-144 | 100 | 4 | 4 |
| 1-152 | 100 | 4 | 4 |
| 1-153 | 100 | 4 | 4 |
| 1-164 | 100 | 4 | 4 |

表 62

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Ec | Se |
|-------|-------------|----|----|
| 1-172 | 100 | 5 | 5 |
| 1-186 | 100 | 5 | 4 |
| 1-192 | 100 | 4 | 4 |
| 1-193 | 100 | 5 | 4 |
| 1-194 | 100 | 5 | 4 |
| 1-195 | 100 | 5 | 4 |
| 1-196 | 100 | 5 | 4 |
| 1-198 | 100 | 4 | 4 |
| 1-214 | 100 | 4 | 4 |
| 1-218 | 100 | 4 | 4 |
| 1-220 | 100 | 5 | 5 |
| 1-221 | 100 | 4 | 4 |
| 1-251 | 100 | 4 | 4 |
| 1-267 | 100 | 4 | 4 |
| 1-270 | 100 | 4 | 4 |
| 1-330 | 100 | 4 | 4 |
| 1-331 | 100 | 4 | 4 |
| 1-333 | 100 | 4 | 4 |
| 1-334 | 100 | 4 | 4 |
| 1-401 | 100 | 5 | 5 |
| 1-402 | 100 | 5 | 4 |
| 1-403 | 100 | 4 | 4 |
| 1-404 | 100 | 5 | 4 |
| 1-407 | 100 | 4 | 4 |
| 1-409 | 100 | 4 | 4 |
| 1-410 | 100 | 4 | 4 |
| 1-411 | 100 | 4 | 4 |
| 1-412 | 100 | 4 | 4 |
| 1-416 | 100 | 5 | 4 |
| 1-417 | 100 | 4 | 5 |
| 1-419 | 100 | 4 | 5 |
| 1-424 | 100 | 4 | 4 |
| 1-426 | 100 | 4 | 4 |
| 1-427 | 100 | 4 | 4 |
| 1-428 | 100 | 4 | 4 |
| 1-430 | 100 | 4 | 4 |
| 1-431 | 100 | 4 | 4 |
| 1-432 | 100 | 5 | 4 |
| 1-434 | 100 | 4 | 4 |
| 1-435 | 100 | 4 | 4 |
| 1-436 | 100 | 4 | 4 |
| 1-437 | 100 | 4 | 4 |
| 1-441 | 100 | 4 | 4 |
| 1-442 | 100 | 4 | 4 |
| 1-445 | 100 | 5 | 5 |
| 1-446 | 100 | 5 | 4 |
| 1-447 | 100 | 5 | 4 |
| 1-449 | 100 | 4 | 4 |
| 1-450 | 100 | 4 | 4 |
| 1-451 | 100 | 4 | 4 |
| 1-452 | 100 | 4 | 4 |
| 1-454 | 100 | 4 | 4 |
| 1-455 | 100 | 4 | 4 |

表 63

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Ec | Se |
|-------|-------------|----|----|
| 1-459 | 100 | 4 | 4 |
| 1-461 | 100 | 4 | 4 |
| 1-463 | 100 | 4 | 4 |
| 1-464 | 100 | 4 | 4 |
| 1-473 | 100 | 5 | 4 |
| 1-482 | 100 | 5 | 4 |
| 1-484 | 100 | 5 | 5 |
| 1-486 | 100 | 4 | 4 |
| 1-488 | 100 | 5 | 4 |
| 1-489 | 100 | 4 | 4 |
| 1-490 | 100 | 4 | 4 |
| 1-492 | 100 | 5 | 4 |
| 1-493 | 100 | 4 | 4 |
| 1-494 | 100 | 5 | 4 |
| 1-496 | 100 | 4 | 4 |
| 1-497 | 100 | 4 | 4 |
| 1-504 | 100 | 5 | 4 |
| 1-505 | 100 | 5 | 5 |
| 1-506 | 100 | 4 | 4 |
| 1-507 | 100 | 4 | 4 |
| 1-508 | 100 | 4 | 4 |
| 1-517 | 100 | 4 | 4 |
| 1-519 | 100 | 4 | 4 |
| 1-526 | 100 | 5 | 4 |
| 1-527 | 100 | 4 | 4 |
| 1-528 | 100 | 4 | 4 |
| 1-529 | 100 | 5 | 4 |
| 1-530 | 100 | 4 | 4 |
| 1-532 | 100 | 5 | 4 |
| 1-536 | 100 | 4 | 4 |
| 1-537 | 100 | 4 | 4 |
| 1-538 | 100 | 4 | 4 |
| 1-539 | 100 | 4 | 4 |
| 1-540 | 100 | 4 | 4 |
| 1-541 | 100 | 4 | 4 |
| 1-546 | 100 | 4 | 4 |
| 1-547 | 100 | 4 | 4 |
| 1-558 | 100 | 4 | 4 |
| 1-559 | 100 | 4 | 4 |
| 1-560 | 100 | 4 | 4 |
| 1-561 | 100 | 5 | 4 |
| 1-563 | 100 | 5 | 4 |
| 1-565 | 100 | 5 | 4 |
| 1-566 | 100 | 4 | 4 |
| 1-569 | 100 | 5 | 4 |
| 1-571 | 100 | 4 | 4 |
| 1-572 | 100 | 4 | 4 |
| 1-579 | 100 | 4 | 4 |
| 1-584 | 100 | 4 | 4 |
| 1-586 | 100 | 5 | 4 |
| 1-589 | 100 | 4 | 4 |
| 1-591 | 100 | 4 | 4 |
| 1-592 | 100 | 5 | 4 |

表 64

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Ec | Se |
|-------|-------------|----|----|
| 1-594 | 100 | 5 | 5 |
| 1-598 | 100 | 4 | 4 |
| 1-600 | 100 | 5 | 4 |
| 1-602 | 100 | 4 | 4 |
| 1-606 | 100 | 4 | 4 |
| 1-607 | 100 | 4 | 4 |
| 1-609 | 100 | 4 | 4 |
| 1-611 | 100 | 4 | 4 |
| 1-617 | 100 | 4 | 4 |
| 1-619 | 100 | 4 | 4 |
| 1-622 | 100 | 4 | 4 |
| 1-642 | 100 | 4 | 4 |
| 2-11 | 100 | 5 | 4 |
| 2-12 | 100 | 5 | 4 |
| 2-23 | 100 | 4 | 4 |
| 2-25 | 100 | 5 | 4 |
| 2-46 | 100 | 4 | 4 |
| 2-50 | 100 | 4 | 4 |
| 2-51 | 100 | 4 | 4 |
| 2-53 | 100 | 4 | 4 |
| 2-57 | 100 | 5 | 5 |
| 2-60 | 100 | 4 | 4 |
| 2-61 | 100 | 4 | 4 |
| 2-62 | 100 | 4 | 4 |
| 2-71 | 100 | 5 | 4 |
| 2-74 | 100 | 4 | 4 |
| 2-75 | 100 | 5 | 4 |
| 2-79 | 100 | 4 | 4 |
| 4-2 | 100 | 5 | 4 |

〈試験例 4〉 水田湛水処理による作物選択性試験

100 cm² プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ (E o)、コナギ (M o) の種子を播種し、2 葉のイネ (O r) を移植し、水深 3 cm に湛水した。翌日、製剤例 1 に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を 10 アール当り 25 g とした。その後、温室内で育成し、処理後 21 日目に表 44 の基準に従って除草効果を調査した。結果を表 65～表 69 に示す。

表 65

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Et | Mo | Or |
|-------|-------------|----|----|----|
| 1-4 | 25 | 5 | 4 | 1 |
| 1-13 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-16 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-17 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-18 | 25 | 5 | 4 | 1 |
| 1-20 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-21 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-22 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-23 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-26 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-33 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-34 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-36 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-38 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-39 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-40 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-41 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-42 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-43 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-44 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-45 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-46 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-47 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-48 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-49 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-50 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-51 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-52 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-53 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-54 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-55 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-59 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-60 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-61 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-62 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-63 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-67 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-72 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-74 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-76 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-78 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-81 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-82 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-83 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-84 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-85 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-86 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-87 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-89 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-91 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-93 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-97 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-98 | 25 | 5 | 5 | 1 |

表 66

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Eu | Mo | Or |
|-------|-------------|----|----|----|
| 1-99 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-103 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-104 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-106 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-107 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-113 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-116 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-118 | 25 | 5 | 3 | 0 |
| 1-119 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-120 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-121 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-123 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-124 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-125 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-126 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-130 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-131 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-132 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-133 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-134 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-135 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-136 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-137 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-139 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-140 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-141 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-144 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-145 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-146 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-147 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-150 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-152 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-153 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-161 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-162 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-166 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-167 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-168 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-169 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-170 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-171 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-172 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-175 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-180 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-181 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-182 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-183 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-188 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-189 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-190 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-197 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-200 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-217 | 25 | 5 | 5 | 1 |

表 67

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | E _o | M | Or |
|-------|-------------|----------------|---|----|
| 1-218 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-219 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-220 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-221 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-225 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-226 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-228 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-234 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-250 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-251 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-306 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-321 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-324 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-325 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-329 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-333 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-334 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-401 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-404 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-412 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-416 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-417 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-418 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-425 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-436 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-439 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-441 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-442 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-443 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-444 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-448 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-452 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-454 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-455 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-459 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-461 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-465 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-473 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-483 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-484 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-485 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-486 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-487 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-489 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-490 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-491 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-492 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-493 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-494 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-495 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-496 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-498 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-504 | 25 | 5 | 5 | 1 |

表 68

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | EO | Mo | Or |
|-------|-------------|----|----|----|
| 1-505 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-506 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-507 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-511 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-517 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-519 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-520 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-521 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-527 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-528 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-529 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-530 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-532 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-533 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-541 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-547 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-548 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-549 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-551 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 1-553 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-558 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-566 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-567 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-569 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-572 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-573 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-579 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-584 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-589 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-591 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-593 | 25 | 5 | 4 | 0 |
| 1-594 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-598 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-599 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-604 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-606 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-607 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-608 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-609 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-611 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-614 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-615 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-624 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-626 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-627 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 1-639 | 25 | 5 | 4 | 1 |
| 2-1 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 2-2 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-7 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-8 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 2-19 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-20 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-25 | 25 | 5 | 5 | 1 |

表 69

| 化合物番号 | 濃度 (gai/10a) | EO | M | Or |
|-------|--------------|----|---|----|
| 2-31 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 2-32 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-42 | 25 | 5 | 5 | 0 |
| 2-48 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-50 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-55 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-56 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-57 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-58 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-71 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-73 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-74 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-75 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 2-78 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 4-1 | 25 | 5 | 5 | 1 |
| 4-2 | 25 | 5 | 5 | 1 |

〈試験例 5〉 畑地土壌処理による作物選択性試験

80 cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ (E c)、エノコログサ (S e)、ダイズ (G l)、コムギ (T r)、トウモロコシ (Z e)、の種子を播種して覆土した。製剤例 1 に準じて調製した水和剤を水で希釈し、10 アール当り有効成分が25 gになる様に、10 アール当り100 lを小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表 44 の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表 70 に示す。

表 70

| 化合物番号 | 濃度(gai/10a) | Ec | Se | Gl | Tr | Ze |
|-------|-------------|----|----|----|----|----|
| 1-15 | 25 | 5 | 5 | - | 1 | 1 |
| 1-23 | 25 | 5 | 5 | - | 2 | 1 |
| 1-33 | 25 | 4 | 4 | 0 | 2 | 1 |
| 1-42 | 25 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 |
| 1-45 | 25 | 4 | 5 | 0 | 2 | 0 |
| 1-46 | 25 | 5 | 5 | 1 | 3 | 0 |
| 1-48 | 25 | 4 | 5 | 0 | 1 | 0 |
| 1-49 | 25 | 5 | 5 | 1 | 0 | 3 |
| 1-50 | 25 | 4 | 5 | 3 | 3 | 0 |
| 1-51 | 25 | 5 | 5 | 0 | 1 | 0 |
| 1-53 | 25 | 4 | 5 | 1 | 2 | 0 |
| 1-54 | 25 | 4 | 5 | 0 | 1 | 0 |
| 1-55 | 25 | 5 | 4 | 1 | 1 | 0 |
| 1-56 | 25 | 5 | 5 | 0 | 4 | 3 |
| 1-58 | 25 | 5 | 5 | 0 | 3 | 0 |
| 1-59 | 25 | 5 | 5 | 0 | 1 | 0 |
| 1-60 | 25 | 5 | 5 | 1 | 2 | 0 |
| 1-61 | 25 | 5 | 5 | 1 | 3 | 0 |
| 1-64 | 25 | 4 | 4 | 2 | 3 | 0 |
| 1-65 | 25 | 5 | 5 | 0 | 0 | 0 |
| 1-68 | 25 | 4 | 4 | 0 | 2 | 2 |
| 1-70 | 25 | 5 | 4 | 1 | 4 | 1 |
| 1-71 | 25 | 5 | 5 | - | 3 | 0 |
| 1-75 | 25 | 4 | 4 | 0 | 3 | 2 |
| 1-76 | 25 | 4 | 4 | 0 | 2 | 2 |
| 1-77 | 25 | 5 | 5 | 1 | 3 | 2 |
| 1-78 | 25 | 5 | 5 | 0 | 1 | 0 |
| 1-80 | 25 | 5 | 5 | 0 | 5 | 1 |
| 1-81 | 25 | 4 | 4 | 0 | 1 | 0 |
| 1-83 | 25 | 5 | 5 | 1 | 2 | 1 |
| 1-84 | 25 | 4 | 4 | 0 | 1 | 0 |
| 1-85 | 25 | 4 | 4 | 0 | 1 | 0 |
| 1-89 | 25 | 4 | 5 | 0 | 2 | 2 |
| 1-95 | 25 | 5 | 5 | 1 | 0 | 0 |
| 1-97 | 25 | 4 | 4 | 3 | 1 | 0 |
| 1-98 | 25 | 4 | 5 | 0 | 1 | 1 |
| 1-99 | 25 | 4 | 4 | 0 | 3 | 0 |
| 1-100 | 25 | 5 | 5 | 0 | 2 | 2 |

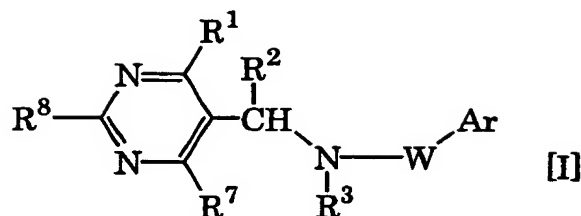
産業上の利用可能性

一般式〔I〕で表される本発明の化合物は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイヌタデ、アオビユ、シロザ、ハコベ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アメリカツノクサネム、アサガオ、オナモミ等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ、キハマスゲ、ヒメクグ、カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生および1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコログサ、スズメノカタビラ、ジョンソングラス、ノスズメノテッポウ、野生エンバク等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮する。また、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ等の一年生雑草及びウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の多年生雑草を防除することもできる。

一方、本発明の除草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

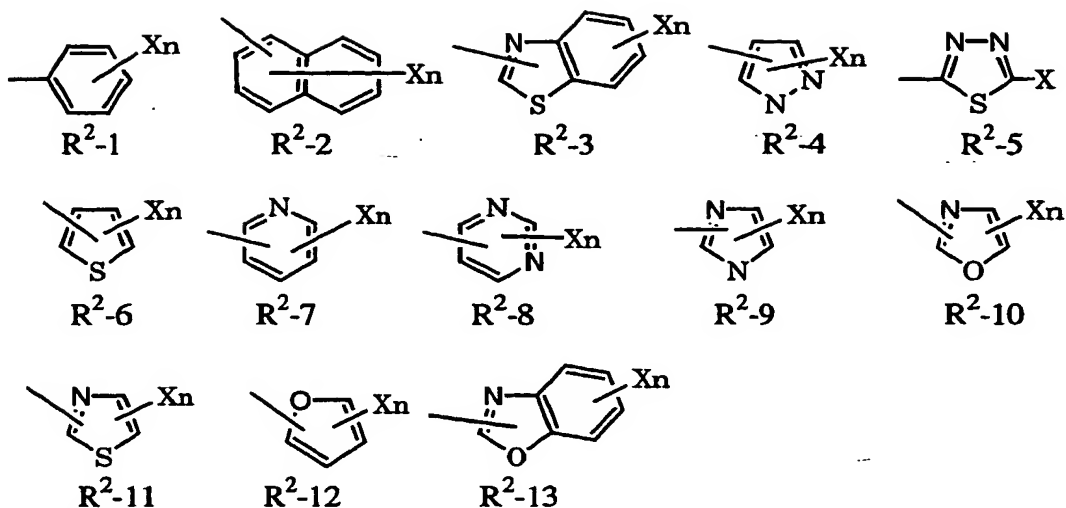
請求の範囲

1. 一般式 [I]



〔式中、 R^1 は水素原子（但し R^2 =水素原子であり $W=SO_2$ の場合は除く）、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルカルボニル C1～C6 アルキル基、ヒドロキシ基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C3～C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C2～C6 アルキニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C4 ハロアルコキシ基、シアノ基、シアノ C1～C6 アルキル基、ニトロ基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、C1～C6 アルキルチオ基（但し R^2 =フェニル基であり $W=SO_2$ の場合は除く）、C2～C6 アルケニルチオ基、C2～C6 アルキニルチオ基、C3～C6 シクロアルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C2～C6 アルケニルスルフィニル基、C2～C6 アルキニルスルフィニル基、C3～C6 シクロアルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C2～C6 アルケニルスルホニル基、C2～C6 アルキニルスルホニル基、C3～C6 シクロアルキルスルホニル基、C1～C6 ヒドロキシアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C2～C6 アルケニル基、カルボキシル基、カルボキシル C1～C6 アルキル基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、

C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキソラニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、アルデヒド基、オキシラニル基、基 NR^9R^{10} 又は基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ を表し、 R^9 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基を表し、 R^{10} は C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、又はベンジルオキシカルボニル基を表し、ここで R^9 及び R^{10} はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員飽和環を形成してもよく、 R^2 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C2～C7 アシル基、シアノ基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキソラニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、シアノ C1～C6 アルキル基、C1～C6 ヒドロキシアルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 又は一般式 $\text{R}^2\text{-1} \sim \text{R}^2\text{-13}$ 。



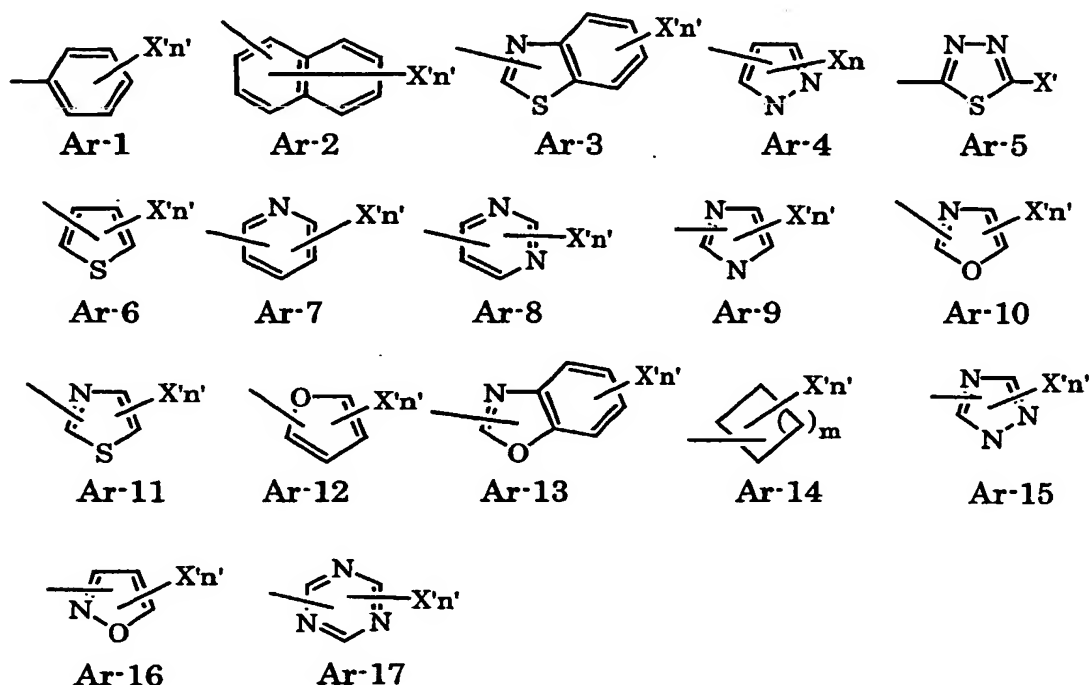
(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、 R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R^3 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、ジ C1～C6 アルキルアミノ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル C1～C6 アルキル基、オキシラニル C1～C6 アルキル基又は C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基を表し、

W は基 $-C(=Q)Z-$ 又は基 $-SO_2-$ を表し、Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、Z は酸素原子、硫黄原子、基 $-NR^6-$ 、基 $-CH_2CH_2-$ 、基 $-CH=CH-$ 、基 $-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(R^4)R^5-Q-$ 、基 $-Q-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(=Q)-$ 、基 $-NR^6$

NR^{6a} —又は基— $\text{NR}^6\text{C}(\text{R}^4)\text{R}^5$ —を表し、 R^4 及び R^5 は水素原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、ハロゲン原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ基又は $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ基を表し、 R^6 及び R^{6a} は水素原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基又は $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基を表し、ここで R^3 及び R^6 はこれらのものが結合する炭素原子と共に5～7員環状ウレアを形成してもよく、

Ar 基は一般式 Ar-1～Ar-17



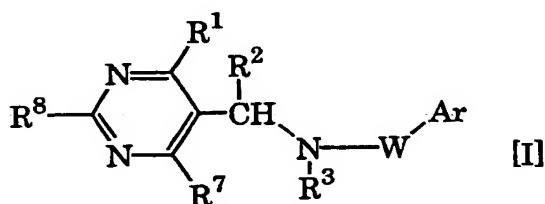
(式中、 X は水素原子、ハロゲン原子、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニル基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルキニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシ $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルコキシ基、 $\text{C}2\sim\text{C}6$ アルケニルオキシ基、 $\text{C}3\sim\text{C}6$ シクロアルキルオキシ基、 $\text{C}2\sim\text{C}7$ アシル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルコキシカルボニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルチオ基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}1\sim\text{C}6$ アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は $\text{C}1\sim\text{C}4$ ハロアルキル基を表し、 n' は1～3の整数を表し、 m は0～3の整数を表し、 n' が2～3の整数の場合は、 X は、同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が2個結合して $\text{C}1\sim\text{C}3$ アルキレンジオキシ基を形成してもよ

い。)の何れかで示される基を表し、

R⁷は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基又は C3～C6 シクロアルキル基を表し、

R⁸は水素原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基又は C3～C6 シクロアルキル基を表す。|で示されるピリミジン誘導体。

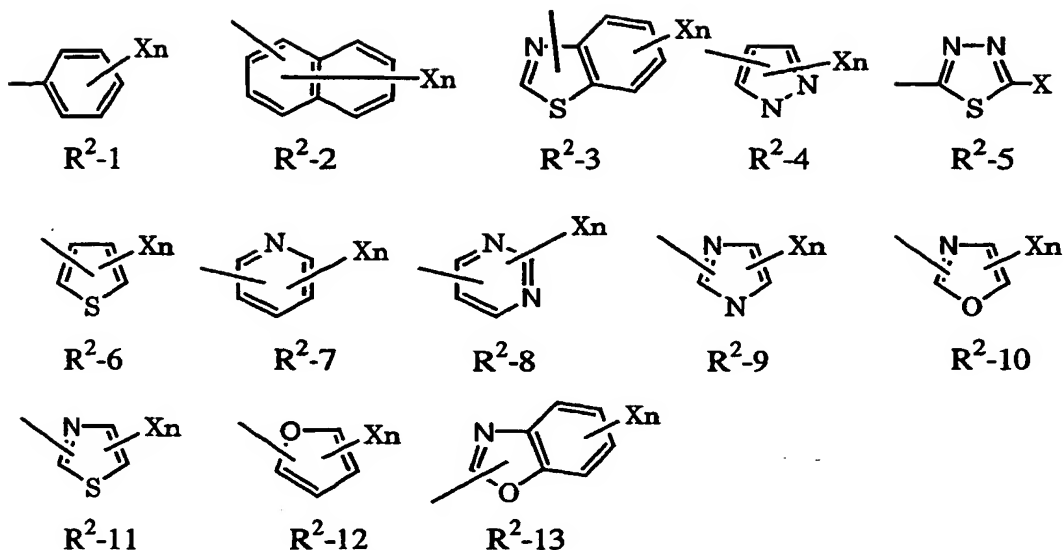
2. 一般式 [I]



式中、R¹は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルカルボニル C1～C6 アルキル基、ヒドロキシ基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C3～C6 シクロアルキル基 (該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。)、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C2～C6 アルキニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、フェニル基 (該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C4 ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基により置換されてもよい。)、C1～C6 アルキルチオ基、C2～C6 アルケニルチオ基、C2～C6 アルキニルチオ基、C3～C6 シクロアルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C2～C6 アルケニルスルフィニル基、C2～C6 アルキニルスルフィニル基、C3～C6 シクロアルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C2～C6 アルケニルスルホニル基、C2～C6 アルキニルスルホニル基、C3～C6 シクロアルキルスルホニル基、ヒドロキシアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ基、シアノ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～

C6 アルコキシカルボニル C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシカルボニル C2~C6 アルケニル基、カルボキシル基、カルボキシル C1~C6 アルキル基、ジ C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシイミノ C1~C6 アルキル基、ヒドロキシイミノ C1~C6 アルキル基、ジオキサニル基（該基は C1~C6 アルキル基が置換されてもよい）、アルデヒド基、オキシラニル基、基 NR^9R^{10} 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ を表し、 R^9 は水素原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C1~C4 ハロアルキル基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ C1~C6 アルキル基、C3~C6 シクロアルキル基、C2~C7 アシル基又は C1~C6 アルキルスルホニル基を表し、 R^{10} は C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C1~C4 ハロアルキル基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ C1~C6 アルキル基、C3~C6 シクロアルキル基、C2~C7 アシル基、C1~C6 アルキルスルホニル基、C1~C6 アルコキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基を表し、ここで R^9 及び R^{10} はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5~7 員飽和環を形成してもよく、

R^2 は水素原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ C1~C6 アルキル基、C3~C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基又は C1~C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C2~C7 アシル基、シアノ基、ジ C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシイミノ C1~C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1~C6 アルキル基、ジオキサニル基（該基は C1~C6 アルキル基が置換されてもよい）、シアノ C1~C6 アルキル基、C1~C6 ヒドロキシアルキル基、C1~C6 アルコキシカルボニル基、C1~C6 アルコキシカルボニル C1~C6 アルキル基、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 又は一般式 $\text{R}^2\text{-1} \sim \text{R}^2\text{-13}$



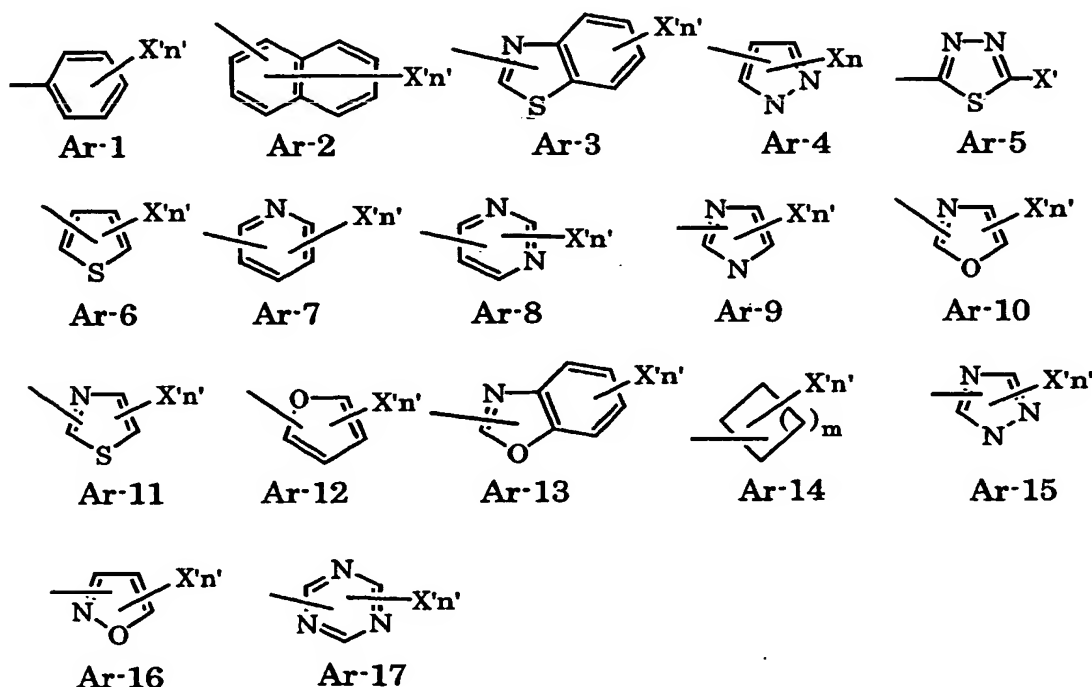
(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、 R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R^3 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、ジ C1～C6 アルキルアミノ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル C1～C6 アルキル基、オキシラニル C1～C6 アルキル基又は C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基を表し、

W は基 $-C(=Q)-Z-$ を表し、Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、Z は酸素原子、硫黄原子、基 $-NR^6-$ 、基 $-CH_2CH_2-$ 、基 $-CH=CH-$ 、基 $-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(R^4)R^5-Q-$ 、基 $-Q-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(=Q)-$ 、基 $-NR^6$ $NR^{6a}-$ 又

は基 $-NR^6C(R^4)R^5-$ を表し、 R^4 及び R^5 は水素原子、C1～C6 アルキル基、ハロゲン原子、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C6 アルキルチオ基を表し、 R^6 及び R^{6a} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基又は C2～C6 アルキニル基を表し、ここで R^3 及び R^6 はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員環状ウレアを形成してもよく、

Ar 基は一般式 Ar-1～Ar-17



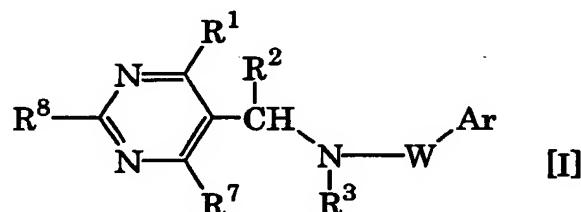
(式中、 X' は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、 n' は 1～3 の整数を表し、 m は 0～3 の整数を表し、 n が 2～3 の整数の場合は、 X' は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アル

コキシ基同士が2個結合して C1~C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。)で示される基を表し、

R⁷は水素原子、ハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又は C3~C6 シクロアルキル基を表し、

R⁸は水素原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又は C3~C6 シクロアルキル基を表す。|で示されるピリミジン誘導体。

3. 一般式 [I]

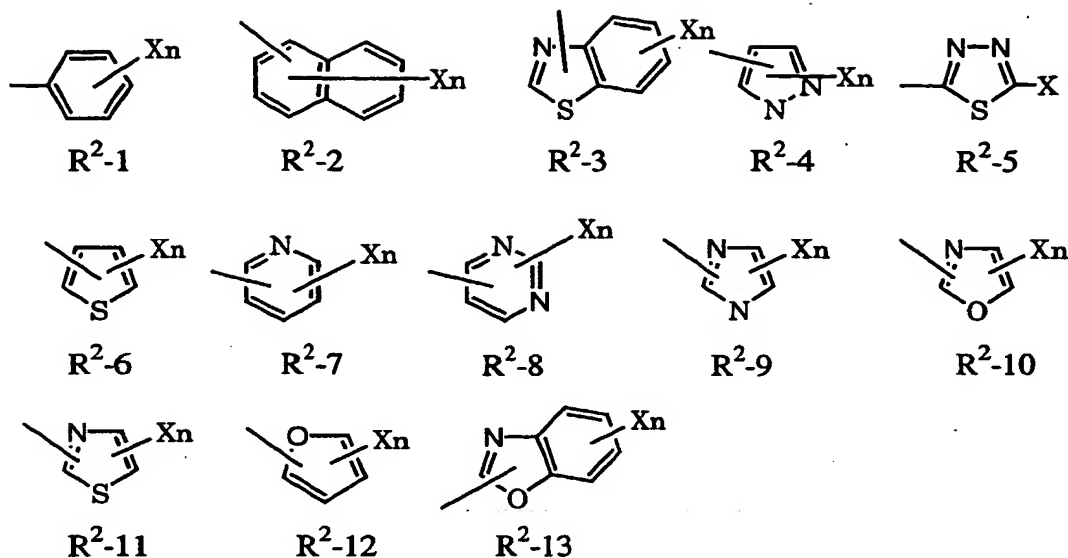


|式中、

R¹はハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、オキソ C1~C6 アルキル基、ヒドロキシ基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C3~C6 シクロアルキル基 (該基はハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基又は C1~C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。)、C1~C4 ハロアルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C4 ハロアルコキシ基、C2~C6 アルケニルオキシ基、C2~C6 アルキニルオキシ基、C3~C6 シクロアルキルオキシ基、フェニル基 (該基はハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C4 ハロアルキル基、C1~C4 ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C6 アルキルスルフィニル基又は C1~C6 アルキルスルホニル基により置換されてもよい。)、C2~C6 アルケニルチオ基、C2~C6 アルキニルチオ基、C3~C6 シクロアルキルチオ基、C1~C6 アルキルスルフィニル基、C2~C6 アルケニルスルフィニル基、C2~C6 アルキニルスルフィニル基、C3~C6 シクロアルキルスルフィニル基、C1~C6 アルキルスルホニル基、C2~C6 アルケニルスルホニル基、C2~C6 アルキニルスルホニル基、C3~C6 シクロアルキルスルホニル基、ヒドロキシアルキル基、C2~C7 アシル基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、シアノ基、シアノ C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシカルボ

ニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C2～C6 アルケニル基、カルボキシル基、カルボキシル C1～C6 アルキル基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキサニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、アルデヒド基、オキシラニル基、基 NR^9R^{10} 又は基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ を表し、 R^9 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基を表し、 R^{10} は C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基を示し、ここで R^9 及び R^{10} はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員飽和環を形成してもよく、

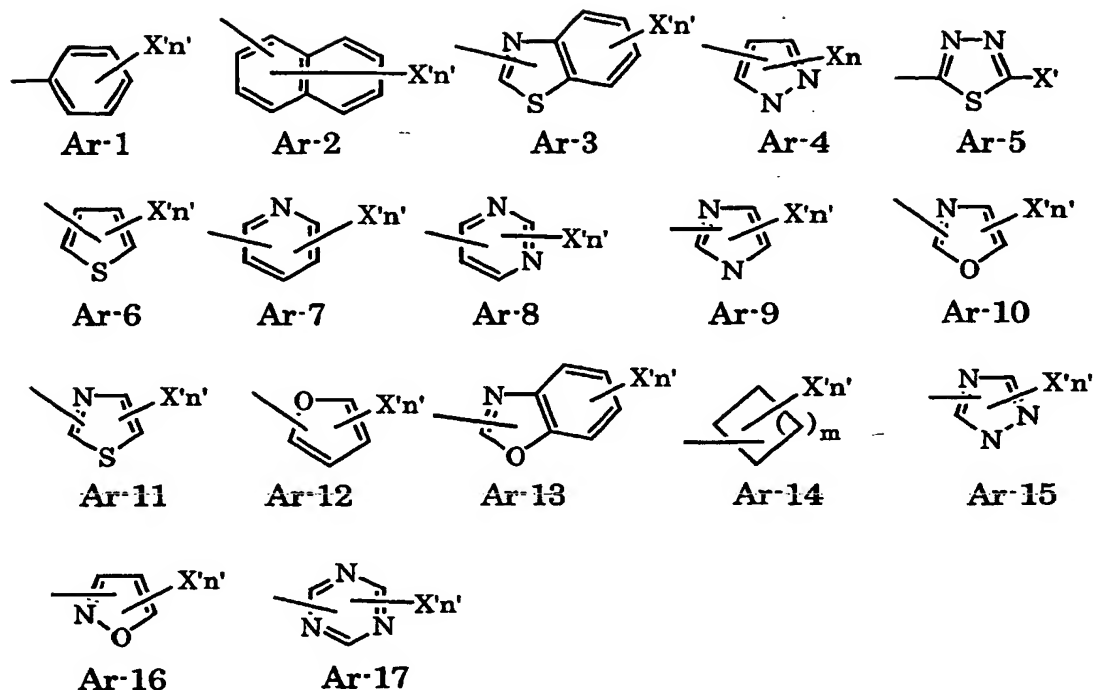
R^2 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C2～C7 アシル基、シアノ基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキサニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、シアノ C1～C6 アルキル基、C1～C6 ヒドロキシアルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、基 $\text{CR}^{11}\text{R}^{12}\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 又は一般式 $\text{R}^2\text{-1} \sim \text{R}^2\text{-13}$



(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基又はニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、 R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、 R^3 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、ジ C1～C6 アルキルアミノ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル C1～C6 アルキル基、オキシラン C1～C6 アルキル基又は C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基を表し、

W は基 $-SO_2-$ を表し、

Ar 基は一般式 Ar-1～Ar-17

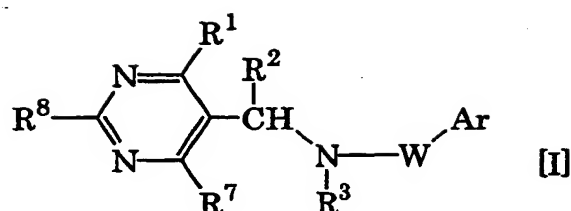


(式中、X'は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、 n' は 1～3 の整数を表し、 m は 0～3 の整数を表し、 n' が 2～3 の整数の場合は、X'は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) で示される基を表し、

R^7 は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基又は C3～C6 シクロアルキル基を表し、

R^8 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基又は C3～C6 シクロアルキル基を表す。|で示されるピリミジン誘導体。

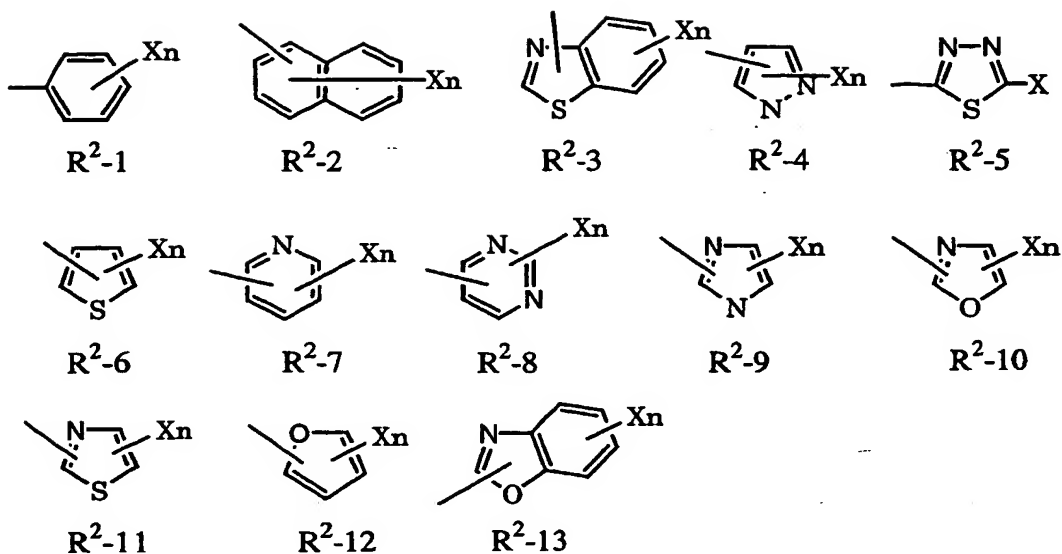
4. 一般式 [I]



〔式中、R¹はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルカルボニル C1～C6 アルキル基、ヒドロキシ基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C3～C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C2～C6 アルキニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C4 ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、C1～C6 アルキルチオ基（但し R²=フェニル基、W=SO₂ の場合は除く）、C2～C6 アルケニルチオ基、C2～C6 アルキニルチオ基、C3～C6 シクロアルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C2～C6 アルケニルスルフィニル基、C2～C6 アルキニルスルフィニル基、C3～C6 シクロアルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C2～C6 アルケニルスルホニル基、C2～C6 アルキニルスルホニル基、C3～C6 シクロアルキルスルホニル基、C1～C6 ヒドロキシアアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ基、シアノ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C2～C6 アルケニル基、カルボキシル基、カルボキシル C1～C6 アルキル基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキソラニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、アルデヒド基、オキシラニル基、基 NR⁹R¹⁰ 又は基 CONR⁹R¹⁰ を表し、

R⁹は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基を表し、R¹⁰は C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基を表し、ここで R⁹ 及び R¹⁰ はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員飽和環を形成してもよく、

R²は C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシ基又は C1～C4 ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C2～C7 アシル基、シアノ基、ジ C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルコキシイミノ C1～C6 アルキル基、ヒドロキイミノ C1～C6 アルキル基、ジオキソラニル基（該基は C1～C6 アルキル基が置換されてもよい）、シアノ C1～C6 アルキル基、C1～C6 ヒドロキシアルキル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル C1～C6 アルキル基、基 CR¹¹ R¹²NR⁹R¹⁰、基 CONR⁹R¹⁰、基 CR¹¹R¹²CONR⁹R¹⁰ 又は一般式 R²-1～R²-13

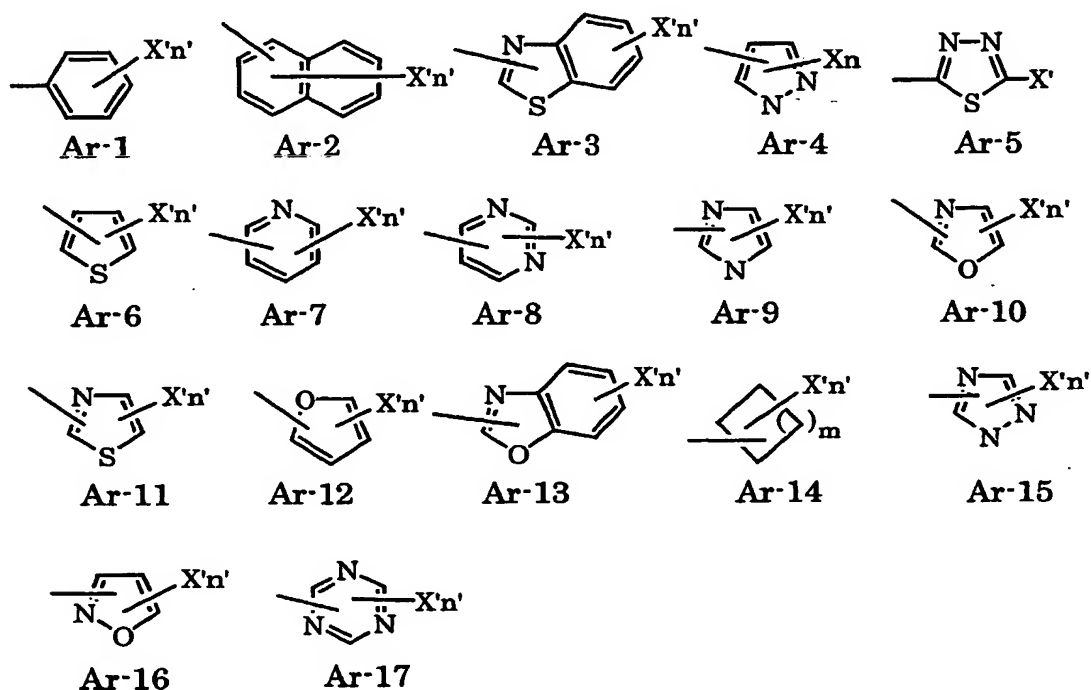


(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $CONR^9R^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、 R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R^3 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、ジ C1～C6 アルキルアミノ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、シアノ C1～C6 アルキル基又は C3～C6 シクロアルキル C1～C6 アルキル基を表し、W は基 $-C(=Q)-$ Z 又は基 $-SO_2-$ を表し、Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、Z は酸素原子、硫黄原子、基 $-NR^6-$ 、基 $-C(R^4)R^5-$ 、基 $-C(R^4)R^5-Q-$ 、基 $-NR^6NR^{6a}-$ 又は基 $-NR^6C(R^4)R^5-$ を表し、 R^4 及び R^5 は水素原子、C1～C6 アルキル基、ハロ

ゲン原子又は C1~C6 アルコキシ基を表し、R⁶ 及び R^{6a} は水素原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基又は C2~C6 アルキニル基を表し、ここで R³ 及び R⁶ はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5~7 員環状ウレアを形成してもよく、

Ar 基は一般式 Ar-1~Ar-17



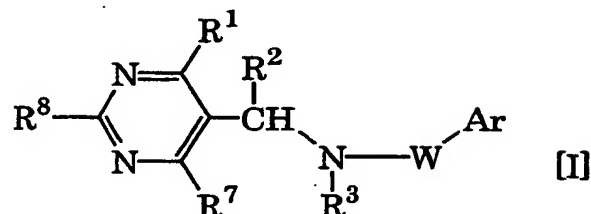
(式中、X'は水素原子、ハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、基 NR⁹R¹⁰、基 CONR⁹R¹⁰、C1~C4 ハロアルコキシ基、C2~C6 アルケニルオキシ基、C3~C6 シクロアルキルオキシ基、C2~C7 アシル基、C1~C6 アルコキシカルボニル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C6 アルキルスルフィニル基、C1~C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1~C4 ハロアルキル基を表し、n'は 1~3 の整数を表し、m は 0~3 の整数を表し、n' が 2~3 の整数の場合は、X'は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1~C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。)

で示される基を表し、

R⁷は水素原子又はハロゲン原子を表し、

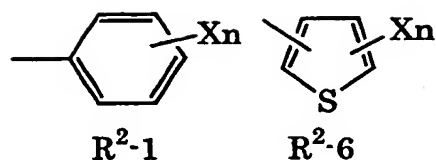
R⁸は水素原子を表す。} で示されるピリミジン誘導体。

5. 一般式 [I]



{式中、R¹はC1～C6アルキル基、C1～C6アルキルカルボニル C1～C6アルキル基、C3～C6シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基又はC1～C4ハロアルキル基により置換されてもよい。）、C1～C4ハロアルキル基、C1～C6アルコキシ基、フェニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6アルキルチオ基、C1～C6アルキルスルフィニル基又はC1～C6アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、C1～C6アルキルチオ基（但しR²=フェニル基、W=SO₂の場合は除く）、C1～C6アルキルスルフィニル基、C2～C7アシル基、C1～C6アルコキシ C1～C6アルキル基、シアノ基、シアノ C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシカルボニル基、C1～C6アルコキシカルボニル C2～C6アルケニル基、カルボキシ基、ジ C1～C6アルコキシ C1～C6アルキル基又はC1～C6アルコキシイミノ C1～C6アルキル基を表し、

R²はC1～C6アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C6アルコキシ C1～C6アルキル基、C1～C6アルキルチオ C1～C6アルキル基、C3～C6シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基又はC1～C4ハロアルキル基により置換されてもよい。）C2～C7アシル基、又は一般式 R²⁻¹ 又は R²⁻⁶



(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、基 NR^9R^{10} 、基 $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ 、C1～C4 ハロアルコキシ基、C2～C6 アルケニルオキシ基、C3～C6 シクロアルキルオキシ基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基、C1～C6 アルキルチオ基、C1～C6 アルキルスルフィニル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又は C1～C4 ハロアルキル基を表し、n は 1～3 の整数を表し、n が 2～3 の整数の場合は、X は同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が 2 個結合して C1～C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。) の何れかで示される基を表し、

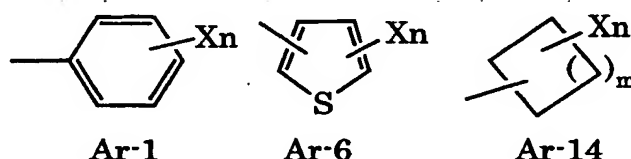
R^9 は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基又は C1～C6 アルキルスルホニル基を表し、 R^{10} は C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C4 ハロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基、C1～C6 アルキルチオ C1～C6 アルキル基、C3～C6 シクロアルキル基、C2～C7 アシル基、C1～C6 アルキルスルホニル基、C1～C6 アルコキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基を表し、ここで R^9 及び R^{10} はこれらのものが結合する炭素原子と共に 5～7 員飽和環を形成してもよく

R^{11} 及び R^{12} は水素原子、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R^3 は、C1～C6 アルキル基、C2～C6 アルケニル基、C2～C6 アルキニル基、C1～C6 アルコキシ基、C3～C6 シクロアルキル基、C1～C6 アルコキシ C1～C6 アルキル基又はシアノ C1～C6 アルキル基を表し、

W は基-C(=Q)Z-又は基-SO₂-を表し、Q は酸素原子又は硫黄原子を表し、Z は、基-NR⁶-、基-C(R⁴)R⁵-、基-C(R⁴)R⁵-Q-、基-NR⁶NR^{6a}-又は基-NR⁶C(R⁴)R⁵-を表し、R⁴及びR⁵は水素原子、C1~C6 アルキル基、ハロゲン原子又はC1~C6 アルコキシ基を表し、R⁶及びR^{6a}は水素原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基又はC2~C6 アルキニル基を表し、ここでR³及びR⁶はこれらのものが結合する炭素原子と共に5~7員環状ウレアを形成してもよく、

Ar 基は一般式 Ar-1、Ar-6 又は Ar-14

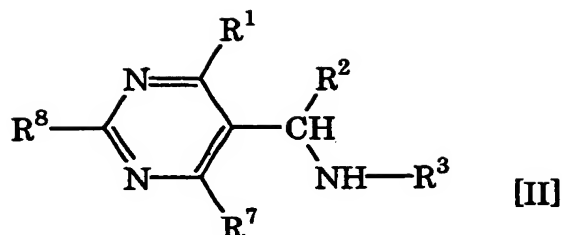


(式中、X は水素原子、ハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C2~C6 アルケニル基、C2~C6 アルキニル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルコキシ C1~C6 アルキル基、基 NR⁹R¹⁰、基 CONR⁹R¹⁰、C1~C4 ハロアルコキシ基、C2~C6 アルケニルオキシ基、C3~C6 シクロアルキルオキシ基、C2~C7 アシル基、C1~C6 アルコキシカルボニル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C6 アルキルスルフィニル基、C1~C6 アルキルスルホニル基、シアノ基、ニトロ基又はC1~C4 ハロアルキル基を表し、n は1~3の整数を表し、m は2~3の整数を表し、n が2~3の整数の場合は、X は、同一でも異なってもよく、又、隣接した低級アルコキシ基同士が2個結合してC1~C3 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。)の何れかで示される基を表し、

R⁷は水素原子、ハロゲン原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルコキシ基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又はC3~C6 シクロアルキル基を表し、

R⁸は水素原子、C1~C6 アルキル基、C1~C6 アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキル基又はC3~C6 シクロアルキル基を表す。}で示されるピリミジン誘導体。

6. 一般式 [II] で示される中間体



〔式中、 R^1 はC1～C6アルキル基、C3～C6シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基又はC1～C4ハロアルキル基により置換されてもよい。）、フェニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6アルキルチオ基、C1～C6アルキルスルフィニル基又はC1～C6アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、C1～C6アルコキシC1～C6アルキル基、ジオキサニル基（該基はC1～C6アルキル基が置換されてもよい）又はジC1～C6アルコキシC1～C6アルキル基を表し、 R^2 はC1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシC1～C6アルキル基、C1～C6アルキルチオC1～C6アルキル基、C3～C6シクロアルキル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基又はC1～C4ハロアルキル基により置換されてもよい。）、フェニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6アルキルチオ基、C1～C6アルキルスルフィニル基又はC1～C6アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、チエニル基（該基はハロゲン原子、C1～C6アルキル基、C1～C6アルコキシ基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4ハロアルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、C1～C6アルキルチオ基、C1～C6アルキルスルフィニル基又はC1～C6アルキルスルホニル基により置換されてもよい。）、ジC1～C6アルコキシC1～C6アルキル基又はジオキサニル基（該基はC1～C6アルキル基が置換されてもよい）を表し、 R^3 は水素原子、C1～C6アルキル基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルキニル基、C1～C6アルコキシ基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C6アルコキシC1～C6アルキル基、シアノC1～C6アルキル基、C3～C6シクロアルキルC1～C6アルキル基、オキシラニルC1～C6アルキル基又はC1～C6アルコキシカル

ボニル C1～C6 アルキル基を表し、

R⁷は水素原子又は C1～C6 アルコキシ基を表し、

R⁸は水素原子、C1～C6 アルキル基又は C3～C6 シクロアルキル基を表す。で示されるピリミジン誘導体。

7. 請求の範囲 1 乃至 5 の何れか 1 項に記載のピリミジン誘導体を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/06165

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D239/26, C07D239/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D239/26, C07D239/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X | EP, 764641, A1 (NISSAN CHEMICAL Ind. Ltd.), 26 March, 1997 (26.03.97), | 6 |
| A | compound in EXAMPLE 2, & WO, 95/12582, A1 & JP, 8-73441, A & US, 5716904, A & CN, 1133589, A | 1-5, 7 |
| X | WO, 96/22980, A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 01 August, 1996 (01.08.96), | 6 |
| A | compound in EXAMPLE 7 & JP, 11-228545, A | 1-5, 7 |
| X | TAKAMIZAWA A. et. al., "Studies on Pyrimidine Derivatives and Related Compounds LXXVII", Chemical & Pharmaceutical Bulletin; vol.21 (No.4), pp.770-784 (1983), p.771, Chart.4, compounds 1-6 | 6 |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not
considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing
date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is
cited to establish the publication date of another citation or other
special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other
means

"P" document published prior to the international filing date but later
than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or
priority date and not in conflict with the application but cited to
understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered novel or cannot be considered to involve an inventive
step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered to involve an inventive step when the document is
combined with one or more other such documents, such
combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
04 December, 2000 (04.12.00)

Date of mailing of the international search report
12 December, 2000 (12.12.00)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁷ C07D239/26, C07D239/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.⁷ C07D239/26, C07D239/32, C07D401/12, C07D403/06,
C07D405/04, C07D409/12, A01N47/38, A01N43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| <u>X</u> | EP, 764641, A1 (NISSAN CHEMICAL Ind.Ltd.) 26.3月.1997(26.03.97) | <u>6</u> |
| <u>A</u> | EXAMPLE 24の化合物参照。 & WO, 95/12582, A1 & JP, 8-73441, A & US, 5716904, A & CN, 1133589, A | <u>1-5, 7</u> |
| <u>X</u> | WO, 96/22980, A1 (日産化学工業株式会社) 01.8月.1996(01.08.96) | <u>6</u> |
| <u>A</u> | EXAMPLE 7の化合物参照。 & JP, 11-228545, A | <u>1-5, 7</u> |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

04.12.00

国際調査報告の発送日

12.12.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

横尾 俊一

4P

7822

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|---|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | TAKAMIZAWA A. et.al. "Studies on Pyrimidine Derivatives and Rerated Compounds LXXVII" Chemical & Pharmaceutical Bulletin;vol.21 (No. 4) p770-784 (1983) 771頁Chart. 4の化合物1～6 参照。 | 6 |